

▼ MURPHY, RAYMOND AUGUST (1987)

▼ Insecticidal N'-substituted-N-alkylcarbonyl-N'-acyl hydrazines

▼ Abstract of EP0232075

- Certain N'-substituted-N-alkylcarbonyl-N'-acyl-hydrazines are new insecticidal compounds and are especially useful, for example in compositions also containing agronomically acceptable diluent or carrier in combating insects of the orders Lepidoptera and Coleoptera. The compounds have the formula:  $\text{R}-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{X})-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{A})-\text{B}$  wherein X and X' are the same or different O, S or NR; R is unsubstituted (C3-C10) branched alkyl or (C1-C4) straight chain alkyl substituted with one or two of the same or different (C3-C6) cycloalkyl; A is unsubstituted or substituted (C1-C10) alkyl unsubstituted or substituted saturated or unsaturated (C3-C8) cycloalkyl or (C3-C8) cycloalkyl-(C1-C4) alkyl unsubstituted or substituted (C2-C8) alkynyl phenalkyl having one to four carbon atoms in the alkyl group and the phenyl ring is unsubstituted or substituted B is unsubstituted or substituted naphthyl or phenyl and agronomically acceptable salts thereof.

⑩ 日本国特許庁(JP)

⑪ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報(A)

昭62-209053

⑬ Int. Cl.<sup>4</sup>

識別記号

庁内整理番号

⑭ 公開 昭和62年(1987)9月14日

C 07 C 109/12  
A 01 N 37/28  
37/34

1 0 1

8318-4H

8519-4H

8519-4H※審査請求 未請求 発明の数 3 (全37頁)

⑮ 発明の名称 殺虫性N'-置換-N-アルキルカルボニル-N'-アシルヒドラジン

⑯ 特 願 昭62-11487

⑰ 出 願 昭62(1987)1月22日

優先権主張 ⑱ 1986年1月22日 ⑲ 米国(US) ⑳ 821187

㉑ 発 明 者 レイモンド オウグス 米国 19446 ペンシルヴァニア州 ランスデイル アパートメント 38-B-1 フォージ ゲート アパートメント  
ト マーフィ

㉒ 発 明 者 アダム チャイータン 米国 19446 ペンシルヴァニア州 ランスデイル ハーグ シュバー ウエイ 1686

㉓ 出 願 人 ローム アンド ハー 米国 19105 ペンシルヴァニア州 フィラデルフィア ス コンパニー インディペンデンス モール ウェスト (番地なし)

㉔ 代 理 人 弁理士 若 林 忠  
最終頁に続く

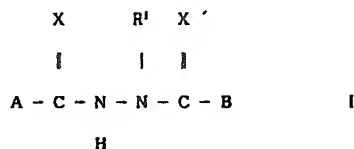
## 明 細 書

## 1. 発明の名称

殺虫性N'-置換-N-アルキルカルボニル-N'-アシルヒドラジン

## 2. 特許請求の範囲

## 1. 式:



(式中)、XおよびX'は同じかまたは異なるO、SまたはNRであり；R<sup>1</sup>は未置換(C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)分枝アルキルまたは同じかまたは異なる(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)シクロアルキルの1種または2種で置換された(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)直鎖アルキルであり；Aは、未置換あるいは、同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシカルボニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルカノイルオキシまたは-NZZ'の1種ないし4種を有する置換(C<sub>1</sub>-

C<sub>10</sub>)アルキル；未置換あるいは、同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルコキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルカノイル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシカルボニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルカノイルオキシまたは-NZZ'の1種ないし4種を有する置換(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)シクロアルキルまたは(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)シクロアルキル(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル；

同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルコキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシカルボニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルカノイルオキシまたは-NZZ'の1種ないし4種を有する、未置換あるいは置換(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルケニルまたは未置換あるいは置換(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルカジエニル；同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、ヒ

ドロキシ、 $(C_1-C_4)$ -アルキル、 $(C_1-C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1-C_4)$ アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ ハロアルコキシ、カルボキシ、 $(C_1-C_4)$ アルコキシカルボニル、 $(C_1-C_4)$ アルカノイルオキシまたは-NZZ'の1種ないし4種を有する、未置換あるいは置換 $(C_3-C_6)$ シクロアルケニルまたは未置換あるいは置換 $(C_3-C_6)$ シクロアルカジエニル；

同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 $(C_1-C_4)$ アルキル、 $(C_1-C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1-C_4)$ アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ ハロアルコキシ、カルボキシ、 $(C_1-C_4)$ アルコキシカルボニル、 $(C_1-C_4)$ アルカノイルオキシまたは-NZZ'の1種ないし4種を有する、未置換あるいは置換 $(C_2-C_6)$ アルキニル；

アルキル基中1~4個の炭素原子を有し、フェニル環が未置換であるか、あるいは同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 $(C_1-C_4)$ アルキル、 $(C_1-C_4)$ ハロアルキ

ル、 $(C_1-C_6)$ アルコキシアルキル；各アルキル基中所定の数の炭素原子を独立に有する $(C_1-C_6)$ アルコキシアルコキシ； $(C_1-C_6)$ アルコキシカルボニルオキシ $(-OC_2R)$ ；ハロ、シアノ、 $(C_1-C_4)$ アルキル、 $(C_1-C_4)$ アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ ハロアルコキシまたは $(C_1-C_4)$ アルキルチオで選択的に置換された $(C_2-C_6)$ アルケニル；カルボキシ；各アルキル基中所定の数の炭素原子を独立に有する $(C_1-C_6)$ アルコキシカルボキシアルキル、 $(-RC_2R')$ ；-COR； $(C_1-C_6)$ ハロアルキルカルボニル； $(C_1-C_6)$ シアノアルキルカルボニル； $(C_1-C_6)$ ニトロアルキルカルボニル； $(C_1-C_6)$ アルコキシカルボニル； $(C_1-C_6)$ ハロアルコキシカルボニル；アルカノイルオキシ $(-OCOR)$ ；アミノ $(-NRR')$ ；ヒドロキシ、 $(C_1-C_4)$ アルコキシまたは $(C_1-C_4)$ アルキルチオ基で置換されたアミノ；フェニルアミノ；ジフェニルアミノ；カルボキサミド $(-CONRR')$ ；カルバモイルオキシ $(-OCONRR')$ ；

ル、 $(C_1-C_4)$ シアノアルキル、 $(C_1-C_4)$ アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ ハロアルコキシ、カルボキシ、 $(C_1-C_4)$ アルコキシカルボニル、 $(C_1-C_4)$ アルカノイルオキシ、 $(C_2-C_6)$ アルケニル、 $(C_2-C_6)$ ハロアルケニル、 $(C_2-C_6)$ アルキニルまたは-NZZ'の1種ないし3種で置換されているフェニルアルキルであり；Bは、未置換または置換ナフチルであって、置換基が同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 $(C_1-C_4)$ アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ アルキル、カルボキシ、 $(C_1-C_4)$ アルコキシカルボニル、 $(C_1-C_4)$ アルカノイルオキシまたは-NZZ'の1種ないし3種でありうる前記置換ナフチルまたは未置換ナフチル；あるいは未置換または置換フェニルであって、置換基が同じかまたは異なるハロ；ニトロ；シアノ；ヒドロキシ； $(C_1-C_6)$ アルキル； $(C_1-C_6)$ ハロアルキル； $(C_1-C_6)$ シアノアルキル； $(C_1-C_6)$ アルコキシ； $(C_1-C_6)$ ハロアルコキシ；各アルキル基中所定の数の炭素原子を独立に有

アミド $(-NRCOR')$ ；アルコキシカルボニルアミノ $(-NRC_2R')$ ；イミド $(-N(COR)COR')$ ； $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニルアミノカルボニルオキシ $(-OCONRCOR')$ ；スルフヒドリル；ハロチオ； $(C_1-C_6)$ アルキルチオ； $(C_1-C_6)$ ハロアルキルチオ；スルフィニル $(-SOR)$ ；スルホニル $(-S_2R)$ ；フェニルスルホニル；スルホネート $(-OSO_2R)$ ； $(C_1-C_6)$ ハロアルキルスルホニルオキシ；スルホナミド $(-S_2NRR')$ ；アルキルスルホナミド $(-NRSOR', -NRS_2R')$ ；アルキルチオカルボニル $(-CSN, CS_2R)$ ；チオアミド $(-NRCSR')$ ；アルキルカルボニルチオ $(-SCOR)$ の1種ないし5種でありうる前記未置換あるいは置換フェニル；未置換、あるいは同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 $(C_1-C_4)$ アルキル、 $(C_1-C_4)$ アルコキシ、カルボキシ、 $(C_1-C_4)$ アルコキシカルボニル、 $(C_1-C_4)$ アルカノイルオキシまたは-NZZ'の1種ないし3種を有する置換フェニル；フェニル環が未置換か、あるいは同じかまた

は異なるハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、  
 $(C_1-C_4)$  アルキル、 $(C_1-C_4)$  アルコキシ、  
 カルボキシ、 $(C_1-C_4)$  アルコキシカルボニル、  
 $(C_1-C_4)$  アルカノイルオキシまたは  
 $-NZZ'$  の1種ないし3種で置換されたフェノキシ；  
 およびフェニル環が未置換であるか、あるいは同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 $(C_1-C_4)$  アルキル、 $(C_1-C_4)$  アルコキシ、カルボキシ、 $(C_1-C_4)$  アルコキシカルボニル、 $(C_1-C_4)$  アルカノイルオキシまたは $-NZZ'$  の1種ないし3種で置換されているか、あるいはフェニル環上の2個の相隣接位置がアルコキシ基で置換されており、これらの基が1緒になって5または6員のジオキサラノまたはジオキサノ複素環式環を形成するフェニルチオであり；ここにRおよびR'は水素または $(C_1-C_6)$  アルキルであり；ZおよびZ'は水素または $(C_1-C_4)$  アルキルである。)で表わされる殺虫活性化合物およびその作物栽培学上許容しうる塩。

たは異なるハロ、ニトロまたは $(C_1-C_4)$  アルキルの1種または2種で置換されているフェニルアルキルであり；

Bが未置換ナフチル；または

未置換または置換フェニルであって、置換基が同じかまたは異なるハロ；ニトロ；シアノ；  
 $(C_1-C_4)$  アルキル； $(C_1-C_4)$  ハロアルキル； $(C_1-C_4)$  シアノアルキル； $(C_1-C_4)$  アルコキシ；各アルキル基中所定の数の炭素原子を独立に有する $(C_1-C_4)$  アルコキシアルキル； $-COZ$ ；カルボキシ； $(C_1-C_4)$  アルコキシカルボニル； $(C_1-C_4)$  アルカノイルオキシ； $-NZZ'$ ； $(C_1-C_4)$  アルキルチオ；アルキルチオカルボニル $(-CSZ, -CS_2Z)$ ；アルキルカルボニルチオ $(-SCOZ)$ の1種ないし3種でありうる前記未置換または置換フェニル；未置換、あるいは同じかまたは異なるハロ、ニトロ、 $(C_1-C_4)$  アルキル、 $(C_1-C_4)$  アルコキシ、カルボキシ、 $(C_1-C_4)$  アルコキシカルボニル、 $(C_1-C_4)$  アルカノイルオキシ、アミノ、 $(C_1$

2. XおよびX'がOまたはSであり；

R'が未置換 $(C_3-C_6)$  分枝アルキル、または同じかまたは異なる $(C_3-C_6)$  シクロアルキルの1種または2種で置換された $(C_1-C_4)$  直鎖アルキルであり；

Aが $(C_1-C_6)$  未置換、あるいは同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、 $(C_1-C_4)$  アルコキシ、カルボキシ、 $(C_1-C_4)$  アルコキシカルボニル、 $(C_1-C_4)$  アルカノイルオキシまたは $-NZZ'$  の1種ないし3種を有する置換アルキル；

$(C_3-C_6)$  シクロアルキル；

$(C_3-C_6)$  未置換、あるいは同じかまたは異なるハロ、 $(C_1-C_4)$  アルキル、 $(C_1-C_4)$  ハロアルキル、 $(C_1-C_4)$  アルコキシまたは $(C_1-C_4)$  ハロアルコキシの1種ないし3種を有する置換アルケニル；

$(C_3-C_6)$  シクロアルケニル；または

アルキル基中に1個または2個の炭素原子を有し、フェニル環が未置換か、あるいは同じかま

$-C_4)$  アルキルアミノまたは各アルキル基中所定の数の炭素原子を独立に有する $(C_1-C_4)$  ジアルキルアミノの1種ないし2種を有する置換フェニル；およびフェノキシであって、フェニル環が未置換であるか、あるいは同じかまたは異なるハロ、ニトロ、 $(C_1-C_4)$  アルキル、 $(C_1-C_4)$  アルコキシ、カルボキシ、 $(C_1-C_4)$  アルコキシカルボニル、 $(C_1-C_4)$  アルカノイルオキシ、アミノ、 $(C_1-C_4)$  アルキルアミノまたは各アルキル基中所定の数の炭素原子を独立に有する $(C_1-C_4)$  ジアルキルアミノの1種または2種で置換されているか；あるいは

フェニル環の2個の隣接する位置がアルコキシ基で置換され、これらのアルコキシ基が一緒になって5もしくは6員のジオキサラノまたはジオキサノ複素環式環を形成することができる前記フェノキシである特許請求の範囲第1項記載の化合物およびその作物栽培学上許容しうる塩。

## 3. XおよびX'がOまたはSであり;

R<sup>1</sup>が分枝(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルであり;

Aが(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)未置換、あるいは同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシカルボニルの1種ないし3種を有する置換アルキル; シクロヘキシル; (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)未置換、あるいは同じかまたは異なるハロまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルの1種ないし3種を有する置換アルケニル; シクロヘキセニル; またはベンジルであって、フェニル環が未置換であるか、または同じかまたは異なるハロ、メチルまたはエチルの1種または2種で置換されている前記ベンジルであり;

Bが未置換ナフチル; あるいは

未置換、または同じかまたは異なるハロ; ニトロ; シアノ; (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル; (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキル; (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)シアノアルキル; (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ; COZ; (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシカルボニル; (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルカノイルオキシの1種ないし3種を有する置換フェニル;

未置換または置換フェニルである特許請求の範囲第3項記載の化合物およびその作物栽培学上許容しうる塩。

## 5. XおよびX'がOであり;

R<sup>1</sup>が $\alpha$ -ブチル、ネオペンチル(2,2-ジメチルプロピル)または1,2,2-トリメチルプロピルであり;

Aが(C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>)未置換アルキル; シクロヘキシル; (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)未置換あるいは同じかまたは異なるクロロ、ブロモまたはメチルの1種ないし3種を有する置換直鎖アルケニル; シクロヘキセニル; またはベンジルであり;

Bが未置換または置換フェニルであって、置換基が同じかまたは異なるクロロ、フルオロ、ブロモ、ヨード、メチル、エチル、メトキシまたはトリフルオロメチルの1種または2種でありうる前記未置換または置換フェニルである特許請求の範囲第4項記載の化合物およびその作物栽培学上許容しうる塩。

6. XおよびX'がOであり; R<sup>1</sup>が $\alpha$ -ブチルで

または未置換または同じかまたは異なるハロ、ニトロ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシカルボニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルカノイルオキシまたは-NZ<sub>2</sub>Z'の1種または2種を有する置換フェニルである特許請求の範囲第2項記載の化合物およびその作物栽培学上許容しうる塩。

## 4. XおよびX'がOであり;

R<sup>1</sup>が分枝(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)アルキルであり;

Aが(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)未置換、あるいは同じかまたは異なるハロの1種ないし2種を有する置換アルキル; シクロヘキシル; (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)未置換、あるいは同じかまたは異なるハロ、メチルまたはエチルの1種ないし3種を有する置換アルケニル; シクロヘキセニル; またはベンジルであり;

Bが未置換または置換フェニルであって、置換基が同じかまたは異なるハロ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキルの1種ないし3種でありうる前記

あり;

Bがフェニルであって、Aがシクロヘキシル、 $n$ -ブチル、 $n$ -プロピル、ベンジル、1-シクロヘキセニル、ジシクロメチルおよびトリクロロメチルよりなる群から選ばれ; Bが4-クロロフェニルであって、Aが $n$ -プロピルおよび $\alpha$ -ブチルよりなる群から選ばれ、Bが3-メチルフェニルであつて、Aがノルボニル、シクロヘキシ-3-エニル、1-ブテニル、3-ブテニル、シス-3,4-ジヒドロキシシクロヘキシル、2,2-ジメチル-3a, 4,5,6,7,7a-ヘキサヒドロベンゾ[d]-ジオキサノ-5-イル、3-アセチル-2,2-ジメチルシクロブチル-メチルおよび2-メチルシクロヘキシルジ-2,5-エニルからなる群から選ばれるか; あるいはBが3,5-ジメチルフェニルであつて、Aがイソプロピルおよび1-メチルエチニルからなる群より選ばれる特許請求の範囲第1項記載の化合物。

7. Bが未置換フェニル、4-クロロフェニル、

- 3-置換-フェニル、2-置換フェニルまたはジ置換フェニルである特許請求の範囲第2項記載の化合物。
8. 作物栽培学上許容しうる担体および殺虫有効量の、特許請求の範囲第1項ないし第7項のいずれかに記載の化合物よりなる殺虫性組成物。
9. 該化合物が、組成物中約0.0001ないし約99重量%存在する特許請求の範囲第8項記載の組成物。
10. 該化合物が、組成物中約0.001ないし約99重量%存在する特許請求の範囲第8項記載の組成物。
11. 該化合物が、組成物中約0.01ないし約99重量%存在する特許請求の範囲第8項記載の組成物。
12. 該作物栽培学上許容しうる担体が固体である特許請求の範囲第8項記載の殺虫性組成物。
13. さらに分散剤を含有し、該組成物が水和剤の形である特許請求の範囲第12項記載の殺虫性組成物。
14. さらに液状の作物栽培学上許容しうる担体および分散剤を含有し、該組成物がフロアブルの形である特許請求の範囲第12項記載の殺虫性組成物。
15. 該組成物が粉剤の形である特許請求の範囲第12項記載の殺虫性組成物。
16. さらに結合剤を含有し該組成物が粒剤の形である特許請求の範囲第12項記載の殺虫性組成物。
17. さらに誘引剤を含有し、該組成物がベイトの形である特許請求の範囲第12項記載の殺虫性組成物。
18. 該作物栽培学上許容しうる担体が液体である特許請求の範囲第8項記載の殺虫性組成物。
19. さらに乳化剤を含有し、該組成物が乳剤の形である特許請求の範囲第8項記載の殺虫性組成物。
20. 該化合物が、  
N'-*tert*-ブチル-N-シクロヘキシル-カルボニル-N'-ベンゾイルヒドラジン、
- N'-*tert*-ブチル-N-n-ブチリル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、  
N'-*tert*-ブチル-N-n-バレリル-N'-ベンゾイルヒドラジン、  
N'-*tert*-ブチル-N<sup>n</sup>-*tert*-ブチリル-N'-ベンゾイルヒドラジン、  
N'-*tert*-ブチル-N-~~ベン~~ベンジルオイル-N'-ベンゾイルヒドラジン、  
N'-*tert*-ブチル-N-*tert*-ブチカルボニル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、  
N'-*tert*-ブチル-N-(1-シクロヘキセニル)カルボニル-N'-ベンゾイルヒドラジン、  
N'-*tert*-ブチル-N-ジクロロアセチル-N'-ベンゾイルヒドラジンおよび  
N'-*tert*-ブチル-N-トリクロロアセチル-N'-ベンゾイルヒドラジン  
よりなる群から選ばれる特許請求の範囲第8項記載の殺虫性組成物。
21. 特許請求の範囲第8項記載の殺虫性組成物を、昆虫と接触させることを特徴とする昆虫防除方法。
22. 特許請求の範囲第20項記載の殺虫性組成物を、昆虫と接触させることを特徴とする昆虫防除方法。
23. 該組成物が、ヘクタール当り該化合物約10gないし約10kgの量で施用される特許請求の範囲第21項記載の方法。
24. 該組成物が、ヘクタール当り該化合物約10.0gないし5kgの量で施用される特許請求の範囲第21項記載の方法。
25. 該昆虫が蝶蛾類鱗翅目または甲虫目に属するものである特許請求の範囲第21項記載の方法。
26. 該昆虫が蝶蛾類鱗翅目または甲虫目に属するものである特許請求の範囲第22項記載の方法。
3. 発明の詳細な説明  
本発明は、殺虫剤として有用なN'-置換-N-アルキルカルボニル-N'-アシルヒドラジン、それらの化合物を含有する組成物、およびそれらの

使用方法に関する。

より大きな活性、よりよい選択性、より低い望ましくない環境影響力、低い生産コストおよび多数の公知の殺虫剤抵抗性の昆虫に対する有効性を示す化合物に対する要望などの諸要因のために、すぐれた殺虫活性と望ましい低毒性との組合せを有する化合物の追求は継続して行なわれるものである。

本発明の化合物は、耕作物、観賞植物および森林において害虫を防除するのに特に好適である。

ある種のヒドラジンおよび/またはヒドラジド誘導体がこれまで文献に開示されている。

25 Aust. J. Chem., 523-529(1972)には、一方または両方の窒素原子がアルキル化またはフェニル化された数種N, N'-ジベンジルヒドラジン誘導体が開示されている。これらの化合物にたいして、生物活性は全く開示されていない。

61 Helv. Chim. Acta, 1477-1510(1978)には、数種のN, N'-ジベンゾイルヒドラジンおよびヒドラジド誘導体が開示されている。これらの

ラジンを含有する、ある種のヒドラジン誘導体が開示されている。これらの化合物について生物活性は全く開示されていない。

J. Chem. Soc. (C), 1531-1536(1966)には、N, N'-ジベンゾイルフェニルヒドラジンおよびN-アセチル-N'-ベンゾイル-P-ニトロフェニルヒドラジンが開示されている。これらの化合物について生物活性は全く開示されていない。

56 B Chem. Berichte, 954-962(1923)には、対称ジイソプロピルヒドラジン、対称ジイソブチルおよびN, N'-ジイソブチルジベンゾイルヒドラジンを包含する、ある種の誘導体が開示されている。これらの化合物について生物活性は全く開示されていない。

590 Annalen der Chemie, 1-36(1954)には、N'-メチル-およびN'-(2-フェニル)-イソプロピル-N, N'-ジベンゾイルヒドラジンを包含して、ある種のN, N'-ジベンゾイルヒドラジン誘導体が開示されている。それらの化合物について、生物活性は全く開示されてい

ない。

44 J. A. C. S., 2556-2567(1922)には、イソプロピルヒドラジン、 $(CH_3)_2CH-NH-NH_2$  対称ジイソプロピルヒドラジン、ジベンゾイルイソプロピルヒドラジンおよびある種の誘導体が開示されている。これらの化合物について、生物活性は全く開示されていない。

44 J. A. C. S., 1577-1564(1972)には、イソプロピル、メンチルおよびボルニルセミカルバジドが開示されている。これらの化合物について、生物活性は全く開示されていない。

48 J. A. C. S., 1030-1035(1926)には、対称ジメチルフェニルメチルヒドラジンおよび1, 2-ビス-メチルフェニルメチル-4-フェニルセミカルバジドを含む、ある種の関連化合物が開示されている。これらの化合物について生物活性は全く開示されていない。

27 Bull. Chem. Soc. Japan, 624-627(1954)には、 $\alpha$ ,  $\beta$ -ジベンゾイルフェニルヒド

ない。

J. Chem. Soc., 4191-4198(1952)には、N, N'-ジ-n-プロピルヒドラジンおよびビス-3, 5-ジニトロベンゾイル誘導体が開示されている。それらの化合物について生物活性は全く開示されていない。

32 Zhur. Obs. Khim., 2806-2809(1962)には、N'-2,4-メチル-2,4-ペンタジエン-N, N'-ジベンゾイルヒドラジンが開示されている。生物活性は全く開示されていない。

17 Acta. Chim. Scand., 95-102(1963)には、2-ベンゾイル・チオベンズヒドラジド( $C_6H_5-CS-NH-NH-CO-C_6H_5$ )ならびに1,2-ジベンゾイル-ベンジルヒドラジンを包含するある種のヒドラジンおよびヒドラジン誘導体が開示されている。これらの化合物について、生物活性は全く開示されていない。

25 Zhur. Obs. Khim., 1719-1723(1955)には、N, N'-ビス-シクロヘキシルヒドラジンおよびN, N'-ジベンゾイルシクロヘキシルヒド

ジンは開示されている。これらの化合物について生物活性は全く開示されていない。

J. Chem. Soc., 4793 - 4800(1964)には、トリベンゾイルヒドラジンおよびN, N'-ジベンゾイルシクロヘキシルヒドラジンを含めて、ある種のジベンゾイルヒドラジン誘導体が開示されている。これらの化合物について、生物活性は全く開示されていない。

36 J. Prakt. Chem., 197 - 201(1967)には、N'-エチル；N'-n-プロピル；N'-イソブチル；N'-ネオペンチル；N'-n-ヘプチル；およびN'-シクロヘキシルメチル-N, N'-ジベンゾイルヒドラジンを包含する、ある種のジベンゾイルヒドラジン誘導体が開示されている。これらの化合物について、生物活性は全く開示されていない。

26 J. O. C., 4336 - 4340(1961)には、N'-t-ブチル-N, N'-ジー（t-ブトキシカルボニル）ヒドラジドが開示されている。生物活性は全く開示されていない。

41 J. O. C., 3763 - 3765(1976)には、N'-t-ブチル-N-（フェニルメトキシカルボニル）-N'-（クロロカルボニル）ヒドラジドが開示されているが、生物活性は全く開示されていない。

94 J. A. C. S., 7406 - 7416(1972)には、N'-t-ブチル-N, N'-ジメトキシカルボニルヒドラジドが開示されているが、生物活性は全く開示されていない。

39 J. Econ. Ent., 416 - 417(1946)には、ある種のN-フェニル-N'-アシルヒドラジンが開示され、コドリが幼虫に対するそれらの化合物の毒性について評価されている。

(以下余白)

41 J. O. C., 3763 - 3765(1976)には、N'-t-ブチル-N-（フェニルメトキシカルボニル）-N'-（クロロカルボニル）ヒドラジドが開示されている。生物活性は全く開示されていない。

94 J. A. C. S., 7406 - 7416(1972)には、N'-t-ブチル-N, N'-ジメトキシカルボニルヒドラジドが開示されている。生物活性は全く開示されていない。

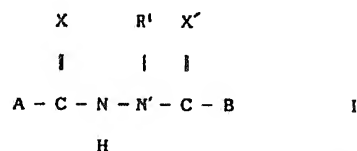
43 J. O. C., 808 - 815(1978)には、N'-t-ブチル-N-エトキシカルボニル-N'-フェニルアミノカルボニルヒドラジドおよびN'-t-ブチル-N-エトキシカルボニル-N'-メチルアミノカルボニルヒドラジドが開示されている。これらの化合物について生物活性は全く開示されていない。

26 J. A. C., 4336 - 4340(1961)には、N'-t-ブチル-N, N'-ジー（t-ブトキシカルボニル）ヒドラジドが開示されているが生物活性は全く開示されていない。

本発明のN'-置換-N-アルキルカルボニル-N'-アシルヒドラジンは、先づ第1にそれらのN-およびN'-置換基により、公知の化合物と異なる。

本発明の化合物は、また蜂蟻類鱗翅目および甲虫目の昆虫に対するすぐれた殺虫活性によっても区別される。

本発明によれば、殺虫性組成物およびこのような組成物の使用方法が提供され、ここに該組成物は、作物栽培学上許容しうる担体および殺虫有効量の式：



（式中、XおよびX'は同じかまたは異なるO,SまたはNRであり；R<sup>1</sup>は未置換（C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>）分枝アルキルまたは同じかまたは異なる（C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>）シクロアルキルの1種または2種で置換された（C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>）直鎖アルキルであり；Aは、未置換あ



るいは、同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 $(C_1-C_4)$ アルコキシ、カルボキシ、 $(C_1-C_4)$ アルコキシカルボニル、 $(C_1-C_4)$ アルカノイルオキシまたは-NZZ'の1種ないし4種を有する置換 $(C_1-C_{10})$ アルキル；未置換あるいは、同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 $(C_1-C_4)$ アルキル、 $(C_1-C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1-C_4)$ アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ ハロアルコキシ、カルボキシ、 $(C_1-C_4)$ アルカノイル、 $(C_1-C_4)$ アルコキシカルボニル、 $(C_1-C_4)$ アルカノイルオキシまたは-NZZ'の1種ないし4種を有する置換 $(C_3-C_8)$ シクロアルキルまたは $(C_3-C_8)$ シクロアルキル $(C_1-C_4)$ アルキル；

同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 $(C_1-C_4)$ アルキル、 $(C_3-C_6)$ シクロアルキル、 $(C_1-C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1-C_4)$ アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ ハロアルコキシ、カルボキシ、 $(C_1-C_4)$ アルコキシカルボニル、 $(C_1-C_4)$ アルカノイルオキシまたは-NZZ'の1種ない

なるハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 $(C_1-C_4)$ アルキル、 $(C_1-C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1-C_4)$ シアノアルキル、 $(C_1-C_4)$ アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ ハロアルコキシ、カルボキシ、 $(C_1-C_4)$ アルコキシカルボニル、 $(C_1-C_4)$ アルカノイルオキシ、 $(C_2-C_6)$ アルケニル、 $(C_2-C_6)$ ハロアルケニル、 $(C_2-C_6)$ アルキニルまたは-NZZ'の1種ないし3種で置換されているフェニルアルキルであり；Bは、未置換または置換ナフチルであって、置換基が同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 $(C_1-C_4)$ アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ アルキル、カルボキシ、 $(C_1-C_4)$ アルコキシカルボニル、 $(C_1-C_4)$ アルカノイルオキシまたは-NZZ'の1種ないし3種でありうる前記置換ナフチルまたは未置換ナフチル；あるいは未置換または置換フェニルであって、置換基が同じかまたは異なるハロ；ニトロ；シアノ；ヒドロキシ； $(C_1-C_6)$ アルキル； $(C_1-C_6)$ ハロアルキル； $(C_1-C_6)$ シアノアルキル； $(C_1-C_6)$ アルコキシ； $(C_1-C_6)$ ハロアルコ

キシ4種を有する、未置換あるいは置換 $(C_2-C_6)$ アルケニルまたは未置換あるいは置換 $(C_2-C_6)$ アルカジエニル；

同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 $(C_1-C_4)$ アルキル、 $(C_1-C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1-C_4)$ アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ ハロアルコキシ、カルボキシ、 $(C_1-C_4)$ アルコキシカルボニル、 $(C_1-C_4)$ アルカノイルオキシまたは-NZZ'の1種ないし4種を有する未置換あるいは $(C_3-C_8)$ シクロアルケニルまたは未置換あるいは置換 $(C_3-C_8)$ シクロアルカジエニル；

同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 $(C_1-C_4)$ アルキル、 $(C_1-C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1-C_4)$ アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ ハロアルコキシ、カルボキシ、 $(C_1-C_4)$ アルコキシカルボニル、 $(C_1-C_4)$ アルカノイルオキシまたは-NZZ'の1種ないし4種を有する、未置換あるいは置換 $(C_2-C_6)$ アルキニル；

アルキル基中1～4個の炭素原子を有し、フェニル環が未置換であるか、あるいは同じかまたは異

キシ；各アルキル基中所定の数の炭素原子を独立に有する $(C_1-C_6)$ アルコキシアルキル；各アルキル基中所定の数の炭素原子を独立に有する

$(C_1-C_6)$ アルコキシアルキル；各アルキル基中所定の数の炭素原子を独立に有する $(C_1-C_6)$ アルコキシアルコキシ； $(C_1-C_6)$ アルコキシカルボニルオキシ $(-OCO_2R)$ ；ハロ、シアノ、 $(C_1-C_4)$ アルキル、 $(C_1-C_4)$ アルコキシ、 $(C_1-C_4)$ ハロアルコキシまたは $(C_1-C_4)$ アルキルチオで選択的に置換された $(C_2-C_6)$ アルケニル；各アルキル基中所定の数の炭素原子を独立に有するカルボキシ $(C_1-C_6)$ カルボキシアルキル、 $(-RCO_2R')$ ； $-COR$ ； $(C_1-C_6)$ ハロアルキルカルボニル； $(C_1-C_6)$ シアノアルキルカルボニル； $(C_1-C_6)$ ニトロアルキルカルボニル； $(C_1-C_6)$ アルコキシカルボニル； $(C_1-C_6)$ ハロアルコキシカルボニル；アルカノイルオキシ $(-OCOR)$ ；アミノ $(-NRR')$ ；ヒドロキシ、 $(C_1-C_4)$ アルコキシまたは $(C_1-C_4)$ アルキルチオ基で置換されたアミノ；フェニルアミノ；ジフェニ

ルアミノ；カルボキサミド (-CONR R')；カルバモイルオキシ (-OCONR R')；アミド (-NRCO R')；アルコキシカルボニルアミノ (-NRCO<sub>2</sub> R')；イミド (-N (CON) CO R')；(アルキルカルボニルアミノ)カルボニルオキシ (-OCONRCO R')；スルフヒドリル；ハロチオ；(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルチオ；(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ハロアルキルチオ；スルフィニル (-SOR)；スルホニル (-SO<sub>2</sub> R)；フエニルスルホニル；スルホネート (-OS O<sub>2</sub> R)；(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ハロアルキルスルホニルオキシ；スルホナミド (-SO<sub>2</sub> NR R')；アルキルスルホナミド (-NRSO R', -NRSO<sub>2</sub> R')；アルキルチオカルボニル (-CSR, -CS<sub>2</sub> R)；チオアミド (-NRC S R')；アルキルカルボニルチオ (-SCOR)の1種ないし5種でありうる前記未置換あるいは置換フエニル；未置換、あるいは同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシカルボニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルカノイルオキシまたは-NZZ'の1種ないし3種を有する置換フエニル

また、本発明によれば、上記のごとく記載され定義された式Iで表わされる殺虫性化合物が提供される。

さらに、本発明によれば、これらの化合物および組成物を使用する方法が提供される。

“ハロ”なる用語は、クロロ、フルオロ、ブロモおよびヨードを包含するものと理解されるべきである。それ自体、または他の置換の1部としての用語「アルキル」は、他に明記しない限り、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、t-ブチル、イソブチル、ネオペンチル、などの直鎖もしくは分枝鎖基を包含し、高級同族体または異性体を表わすときには、n-オクチル、イソオクチルなどを包含する。それ自体または他の置換基の1部としての用語「ハロアルキル」は、クロロメチル、1-もしくは2-ブロモエチル、トリフルオロメチルなど、それに結合される1種以上のハロゲン原子を有する、所定の数の炭素原子のアルキル基である。同様に、それ自体または他の基の1部としての「シアノアルキル」

；フエニル環が未置換か、あるいは同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシカルボニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルカノイルオキシまたは-NZZ'の1種ないし3種で置換されたフエノキシ；およびフエニル環が未置換であるか、あるいは同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシカルボニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルカノイルオキシまたは-NZZ'の1種ないし3種で置換されているか、あるいはフエニル環上の2個の相隣接位置がアルコキシ基で置換されており、これらの基が1緒になって5または6員のジオキサソラノまたはジオキサノ複素環式環を形成するフエニルチオであり；ここにRおよびR'は水素または(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルであり；ZおよびZ'は水素または(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルである。)で表わされる化合物；および作物栽培学上許容されるその塩よりなる。

ル」は、それに結合される1種以上のシアノ基を有する、所定の数の炭素原子のアルキル基であり；それ自体または他の基の1部としての「ハロアルコキシ」は、例えばジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ、2,2-トリフルオロエトキシなど、それに結合される1種以上のハロ原子を有する、所定の数の炭素原子のアルコキシ基である。それら自体または他の基の1部としての「アルケニル」および「アルキニル」は、所定の数の炭素原子を有する直鎖または分枝鎖基よりなる。「アルカジエニル」は、1,3-ブタジエニルのように共役することが可能であり、1,2-プロパジエニルのように集積可能であるか、または1,4-ペンタジエニルのように孤立できる2個の炭素-炭素二重結合よりなる直鎖または分枝鎖アルケニル基である。

本発明の範囲内の代表的な化合物は、限定されることなく、下記の化合物を包含する。

N'-t-ブチル-N-アセチル-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-プロピオニル-N'-ベンゾ  
イルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-ブチリール-N'-ベンゾ  
イルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-バレリール-N'-ベンゾ  
イルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-ヘキサノイル-N'-ベンゾ  
イルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-ヘプタノイル-N'-ベンゾ  
イルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-オクタノイル-N'-ベンゾ  
イルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-ノナノイル-N'-ベンゾ  
イルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-デカノイル-N'-ベンゾ  
イルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-ウンデカノイル-N'-ベン  
ゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シアノプロピルカルボニ  
ル-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロブチルカルボニ  
ル-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロペンチルカルボニ  
ル-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロヘキセニルカルボ  
ニル-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロヘプテニルカルボ  
ニル-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロオクテニルカルボ  
ニル-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-プロピオロイル-N'-ベン  
ゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(1-ブチニルカルボ  
ニル)-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(1-ペンチニルカルボ  
ニル)-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(1-ヘキシニルカルボ  
ニル)-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(1-ヘプチニルカルボ  
ニル)-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロブチルカルボニ  
ル-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロヘキシニルカルボ  
ニル-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロヘプチルカルボ  
ニル-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロオクチルカルボ  
ニル-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-アクリロイル-N'-ベン  
ゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-アリルカルボニル-N'-  
ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(1-プロベニルカルボ  
ニル)-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-クロトノイル-N'-ベン  
ゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-イソクロトノイル-N'-  
ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロプロベニルカルボ  
ニル-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(1-オクチニルカルボ  
ニル)-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(2-ブチニルカルボ  
ニル)-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(2-ペンチニルカルボ  
ニル)-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(3-メチル-1-ブチ  
ニルカルボニル)-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(2-ヘキシニルカルボ  
ニル)-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(3-ヘキシニルカルボ  
ニル)-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(3,3-ジメチル-1-ブ  
チニルカルボニル)-N'-ベンゾイルヒドラ  
ジン、

N'-ε-ブチル-N-(4-オクチニルカルボ  
ニル)-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-ベンジルカルボニル-N'-  
ベンゾイルヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-フェネチルカルボニル-N'

-ベンゾイルヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-(3-フェニルプロピルカルボニル)-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-(4-フェニルブチルカルボニル)-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-(4-(4-クロロフェニル)ブチルカルボニル)-N'-ベンゾイルヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-アセチル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-プロピオニル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-ブチリール-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-バレリール-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-ヘキサノイル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-ヘプタノイル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-アリルカルボニル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-(1-プロベニルカルボニル)-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-(1-プロベニルカルボニル)-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-クロトノイル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-イソクロトノイル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-シクロプロベニルカルボニル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-シクロブテニルカルボニル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-シクロペンチルカルボニル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-シクロヘキセニルカルボニル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-オクタノイル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-ノナノイル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-デカノイル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-ウンデカノイル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-シクロプロピルカルボニル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-シクロブチルカルボニル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-シクロヘキシルカルボニル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-シクロヘプチルカルボニル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-シクロオクチルカルボニル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-アクリロイル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

ル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-シクロヘプテニルカルボニル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-シクロオクテニルカルボニル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-プロピオロイル-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-(1-ブチニルカルボニル)-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-(1-ペンチニルカルボニル)-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-(1-ヘキシニルカルボニル)-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-(1-ヘプチニルカルボニル)-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-t-ブチル-N-(1-オクチニルカルボニル)-N'-(4-クロロベンゾイル)ヒドラジン、

ル) - N' - (4-クロロベンゾイル) ヒドラジ  
ン、

N' - ヒ - プチル - N - (2-ブチニルカルボニ  
ル) - N' - (4-クロロベンゾイル) ヒドラジ  
ン、

N' - ヒ - プチル - N - (2-ペンチニルカルボニ  
ル) - N' - (4-クロロベンゾイル) ヒドラジ  
ン、

N' - ヒ - プチル - N - (3-メチル-1-ブチニ  
ルカルボニル) - N' - (4-クロロベンゾイル)  
ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - (2-ヘキシニルカルボニ  
ル) - N' - (4-クロロベンゾイル) ヒドラジ  
ン、

N' - ヒ - プチル - N - (3-ヘキシニルカルボニ  
ル) - N' - (4-クロロベンゾイル) ヒドラジ  
ン、

N' - ヒ - プチル - N - (3,3-ジメチル-1-ブ  
チニルカルボニル) - N' - (4-クロロベンゾイ  
ル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - ブチリール - N' - (3-ト  
ルオイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - バレリール - N' - (3-ト  
ルオイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - ヘキサノイル - N' - (3-  
トルオイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - ヘプタノイル - N' - (3-  
トルオイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - オクタノイル - N' - (3-  
トルオイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - ノナノイル - N' - (3-ト  
ルオイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - デカノイル - N' - (3-ト  
ルオイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - ウンデカノイル - N' - (3-  
トルオイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - シクロプロピルカルボニ  
ル - N' - (3-トルオイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - シクロブチルカルボニル -  
N' - (3-トルオイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - (4-オクチニルカルボニ  
ル) - N' - (4-クロロベンゾイル) ヒドラジ  
ン、

N' - ヒ - プチル - N - ベンジルカルボニル - N' -  
(4-クロロベンゾイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - フェネチルカルボニル - N'  
- (4-クロロベンゾイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - (3-フェニルプロピルカ  
ルボニル) - N' - (4-クロロベンゾイル) ヒド  
ラジン、

N' - ヒ - プチル - N - (4-フェニルブチルカル  
ボニル) - N' - (4-クロロベンゾイル) ヒドラ  
ジン、

N' - ヒ - プチル - N - (4-(4-クロロフェニ  
ル)ブチルカルボニル) - N' - (4-クロロベン  
ゾイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - アセチル - N' - (3-トル  
オイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - プロピオニル - N' - (3-  
トルオイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - シクロヘキシルカルボニ  
ル - N' - (3-トルオイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - シクロヘプチルカルボニ  
ル - N' - (3-トルオイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - シクロオクチルカルボニ  
ル - N' - (3-トルオイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - アクリロイル - N' - (3-  
トルオイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - アリルカルボニル - N' -  
(3-トルオイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - (1-プロペニルカルボニ  
ル) - N' - (3-トルオイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - クロトノイル - N' - (3-  
トルオイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - イソクロトノイル - N' -  
(3-トルオイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - シクロプロベニルカルボニ  
ル - N' - (3-トルオイル) ヒドラジン、

N' - ヒ - プチル - N - シクロブテニルカルボニ  
ル - N' - (3-トルオイル) ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-シクロベンチルカルボニル-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-シクロヘキセニルカルボニル-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-シクロヘプテニルカルボニル-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-シクロオクテニルカルボニル-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-プロピオロイル-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-(1-ブチニルカルボニル)-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-(1-ペンチニルカルボニル)-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-(1-ヘキシニルカルボニル)-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-(1-ヘプテニルカルボニル)-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-(1-オクチニルカルボニル)-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-(3-フェニルプロピルカルボニル)-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-(4-フェニルブチルカルボニル)-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-(4-(4-クロロフェニル)ブチルカルボニル)-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-アセチル-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-プロピオニル-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-ブチリル-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-バレリル-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-ヘキサノイル-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-ヘプタノイル-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-(2-ブチニルカルボニル)-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-(2-ペンチニルカルボニル)-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-(3-メチル-1-ブチニルカルボニル)-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-(2-ヘキシニルカルボニル)-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-(3-ヘキシニルカルボニル)-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-(3,3-ジメチル-1-ブチニルカルボニル)-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-(4-オクチニルカルボニル)-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-ベンジルカルボニル-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-フェネチルカルボニル-N'-(3-トルオイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-オクタノイル-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-ノナノイル-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-デカノイル-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-ウンデカノイル-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-シクロプロピルカルボニル-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-シクロブチルカルボニル-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-シクロヘキシルカルボニル-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-シクロヘプチルカルボニル-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ヒ-ブチル-N-シクロオクチルカルボニル-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

(以下余白)

N'-ε-ブチル-N-アクリロイル-N'-(2-  
メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-アリルカルボニル-N'-(  
2-メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(1-プロペニルカルボニ  
ル)-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジ  
ン、

N'-ε-ブチル-N-クロトノイル-N'-(2-  
メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-イソクロトノイル-N'-(  
2-メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロプロペニルカルボ  
ニル-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジ  
ン、

N'-ε-ブチル-N-シクロブテニルカルボ  
ニル-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロペンチルカルボ  
ニル-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジ  
ン、

N'-ε-ブチル-N-シクロヘキセニルカルボ  
ニル-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジ  
ン、

N'-ε-ブチル-N-(1-オクチニルカルボ  
ニル)-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジ  
ン、

N'-ε-ブチル-N-(2-ブチニルカルボ  
ニル)-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジ  
ン、

N'-ε-ブチル-N-(2-ペンチニルカルボ  
ニル)-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジ  
ン、

N'-ε-ブチル-N-(3-メチル-1-ブチ  
ニルカルボニル)-N'-(2-メトキシベンゾイ  
ル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(2-ヘキシニルカルボ  
ニル)-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジ  
ン、

N'-ε-ブチル-N-(3-ヘキシニルカルボ  
ニル)-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジ  
ン、

N'-ε-ブチル-N-(3,3-ジメチル-1-

ン、

N'-ε-ブチル-N-シクロヘブテニルカルボ  
ニル-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジ  
ン、

N'-ε-ブチル-N-シクロオクテニルカルボ  
ニル-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジ  
ン、

N'-ε-ブチル-N-プロピオロイル-N'-(2-  
メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(1-ブチニルカルボ  
ニル)-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジ  
ン、

N'-ε-ブチル-N-(1-ペンチニルカルボ  
ニル)-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジ  
ン、

N'-ε-ブチル-N-(1-ヘキシニルカルボ  
ニル)-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジ  
ン、

N'-ε-ブチル-N-(1-ヘブチニルカルボ  
ニル)-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジ  
ン、

ブチニルカルボニル)-N'-(2-メトキシベン  
ゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(4-オクチニルカルボ  
ニル)-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒドラジ  
ン、

N'-ε-ブチル-N-ベンジルカルボニル-N'-(  
2-メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-フェネチルカルボニル-N'-(  
2-メトキシベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(3-フェニルプロピルカ  
ルボニル)-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒ  
ドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(4-フェニルブチルカル  
ボニル)-N'-(2-メトキシベンゾイル)ヒド  
ラジン、

N'-ε-ブチル-N-(4-(4-クロロフェ  
ニル)ブチルカルボニル)-N'-(2-メトキシベン  
ゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-アセチル-N'-(3-フル  
オロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-プロピオニル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-ブチリール-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-バレリール-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-ヘキサノイル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-ヘプタノイル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-オクタノイル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-ノナノイル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-デカノイル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-ウンデカノイル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロプロピルカルボニル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

ル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロブチルカルボニル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロペンチルカルボニル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロヘキサニルカルボニル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロヘプテニルカルボニル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロオクテニルカルボニル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-プロピオロイル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(1-ブチニルカルボニル)-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロブチルカルボニル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロヘキサニルカルボニル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロヘプテニルカルボニル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロオクテニルカルボニル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-アクリロイル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-アリルカルボニル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(1-プロペニルカルボニル)-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-クロトノイル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-イソクロトノイル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-シクロプロペニルカルボニル-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(1-ペンチニルカルボニル)-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(1-ヘキシニルカルボニル)-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(1-ヘプテニルカルボニル)-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(1-オクテニルカルボニル)-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(2-ブチニルカルボニル)-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(2-ペンチニルカルボニル)-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、

N'-ε-ブチル-N-(3-メチル-1-ブチニルカルボニル)-N'-(3-フルオロベンゾイル)ヒドラジン、



) ヒドラジン、

$N'$ - $\epsilon$ -ブチル-N-(2-ヘキシニルカルボニル)- $N'$ -(3-フルオロベンゾイル) ヒドラジン、

$N'$ - $\epsilon$ -ブチル-N-(3-ヘキシニルカルボニル)- $N'$ -(3-フルオロベンゾイル) ヒドラジン、

$N'$ - $\epsilon$ -ブチル-N-(3,3-ジメチル-1-ブチニルカルボニル)- $N'$ -(3-フルオロベンゾイル) ヒドラジン、

$N'$ - $\epsilon$ -ブチル-N-(4-オクチニルカルボニル)- $N'$ -(3-フルオロベンゾイル) ヒドラジン、

$N'$ - $\epsilon$ -ブチル-N-ベンジルカルボニル- $N'$ -(3-フルオロベンゾイル) ヒドラジン、

$N'$ - $\epsilon$ -ブチル-N-フェネチルカルボニル- $N'$ -(3-フルオロベンゾイル) ヒドラジン、

$N'$ - $\epsilon$ -ブチル-N-(3-フェニルプロピルカルボニル)- $N'$ -(3-フルオロベンゾイル) ヒドラジン、

ハロ、( $C_1-C_4$ ) アルキル、( $C_1-C_4$ ) ハロアルキル、( $C_1-C_4$ ) アルコキシまたは( $C_1-C_4$ ) ハロアルコキシの1種ないし3種を有する置換アルケニル；

( $C_3-C_6$ ) シクロアルケニル；または

アルキル基中に1個または2個の炭素原子を有し、フェニル環が未置換か、あるいは同じかまたは異なるハロ、ニトロまたは( $C_1-C_4$ ) アルキルの1種または2種で置換されているフェニルアルキルであり；

Bが未置換ナフチル；または

未置換または置換フェニルであって、置換基が同じかまたは異なるハロ；ニトロ；シアノ；( $C_1-C_4$ ) アルキル；( $C_1-C_4$ ) ハロアルキル；( $C_1-C_4$ ) シアノアルキル；( $C_1-C_4$ ) アルコキシ；各アルキル基中所定の数の炭素原子を独立に有する( $C_1-C_4$ ) アルコキシアルキル；-COR；カルボキシ；( $C_1-C_4$ ) アルコキシカルボニル；( $C_1-C_4$ ) アルカノイルオキシ；-NZZ'；( $C_1-C_4$ ) アルキルチオ；アルキルチオカルボニル(-CSZ、

$N'$ - $\epsilon$ -ブチル-N-(4-フェニルブチルカルボニル)- $N'$ -(3-フルオロベンゾイル) ヒドラジン、

$N'$ - $\epsilon$ -ブチル-N-(4-(4-クロロフェニル)ブチルカルボニル)- $N'$ -(3-フルオロベンゾイル) ヒドラジン、

良好な殺虫活性のために、殺虫性組成物および製剤に用いる本発明の化合物は、独立に、

XおよびX'がOまたはSであり；

R'が未置換( $C_3-C_6$ )分枝アルキル、または同じかまたは異なる( $C_3-C_4$ )シクロアルキルの1種または2種で置換された( $C_1-C_4$ )直鎖アルキルであり；

Aが( $C_1-C_6$ )未置換、あるいは同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、( $C_1-C_4$ )アルコキシ、カルボキシ、( $C_1-C_4$ )アルコキシカルボニル、( $C_1-C_4$ )アルカノイルオキシまたは-NZZ'の1種ないし3種を有する置換アルキル；

( $C_3-C_6$ )シクロアルキル；

( $C_2-C_6$ )未置換、あるいは同じかまたは異なる

-CSZ)；アルキルカルボニルチオ(-SCOZ)の1種ないし3種でありうる前記未置換または置換フェニル；未置換、あるいは同じかまたは異なるハロ、ニトロ、( $C_1-C_4$ )アルキル、( $C_1-C_4$ )アルコキシ、カルボキシ、( $C_1-C_4$ )アルコキシカルボニル、( $C_1-C_4$ )アルカノイルオキシ、アミノ、( $C_1-C_4$ )アルキルアミノまたは各アルキル基中所定の数の炭素原子を独立に有する( $C_1-C_4$ )ジアルキルアミノの1種ないし2種を有する置換フェニル；およびフェノキシであって、フェニル環が未置換であるか、あるいは同じかまたは異なるハロ、ニトロ、( $C_1-C_4$ )アルキル、( $C_1-C_4$ )アルコキシ、カルボキシ、( $C_1-C_4$ )アルコキシカルボニル、( $C_1-C_4$ )アルカノイルオキシ、アミノ、( $C_1-C_4$ )アルキルアミノまたは各アルキル基中所定の数の炭素原子を独立に有する( $C_1-C_4$ )ジアルキルアミノの1種または2種で置換されているか；あるいはフェニル環の2個の隣接する位置がアルコキシ基で置換され、これらのアルコキシ基が一緒になっ

て5もしくは6員のジオキサノまたはジオキサノ複素環式環を形成することができる前記フェノキシであり；ここにZおよびZ'は水素または(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルであるもの；および作物栽培学上許容しうる塩を包含する。

本発明の殺虫性組成物および製剤に使用するに当り非常に良好な活性を有する本発明の殺虫性化合物は、独立に、XおよびX'がOまたはSであり；

R'が分枝(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルであり；

Aが(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)未置換、あるいは同じかまたは異なるハロ、シアノ、ニトロ、カルボキシまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシカルボニルの1種ないし3種を有する置換アルキル；シクロヘキシル；(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)未置換、あるいは同じかまたは異なるハロまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルの1種ないし3種を有する置換アルケニル；シクロヘキセニル；またはベンジルであって、フェニル環が未置換であるか、または同じかまたは異なるハロ、メチルまたはエチルの1種または2種で置換されている前記

ベンジルであり；

Bが未置換ナフチル；あるいは

未置換、または同じかまたは異なるハロ；ニトロ；シアノ；(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル；(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキル；(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)シアノアルキル；(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ；-COZ；(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシカルボニル；(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルカノイルオキシの1種ないし3種を有する置換フェニル；または未置換または同じかまたは異なるハロ、ニトロ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシカルボニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルカノイルオキシまたは-NZ'の1種ないし3種を有する置換フェニルであり；ZおよびZ'は水素または(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルであるもの；および作物栽培学上許容しうるそれらの塩を包含する。

そのすぐれた殺虫活性のために、本発明の殺虫性組成物および製剤に用いる本発明の好ましい化合物は、独立に、XおよびX'がOであり；

R<sup>1</sup>が分枝(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルであり；

Aが(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)未置換、あるいは同じかまたは異なるハロの1種ないし2種を有する置換アルキル；シクロヘキシル；(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)未置換、あるいは同じかまたは異なるハロ、メチルまたはエチルの1種ないし3種を有する置換アルケニル；シクロヘキセニル；またはベンジルであり；

Bが未置換または置換フェニルであって、置換基が同じかまたは異なるハロ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキルの1種ないし3種でありうる前記未置換または置換フェニルであるもの；および作物栽培学上許容しうるそれらの塩を包含する。

その顕著な殺虫活性のために、本発明の殺虫性組成物および製剤に用いる本発明の特に好ましい化合物は、独立に、XおよびX'がOであり；

R<sup>1</sup>が $\alpha$ -ブチル、ネオペンチル(2,2-ジメチルプロピル)または1,2,2-トリメチルプロピルであり；

Aが(C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>)未置換アルキル；シクロヘキシル；

同じかまたは異なるクロロ、ブロモまたはメチルの1種ないし3種を有する(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)未置換ないし置換直鎖アルケニル；シクロヘキセニル；またはベンジルであり；

Bが未置換または置換フェニルであって、置換基が同じかまたは異なるクロロ、フルオロ、ブロモ、ヨード、メチル、エチル、メトキシまたはトリフルオロメチルの1種または2種でありうる前記未置換または置換フェニルであるもの；および作物栽培学上許容しうるそれらの塩を包含する。

酸性または塩基性官能基を有する式IのN'-置換-N-アルキルカルボニル-N'-アシルヒドラジンは、適当な塩基または酸と反応して新規な塩を形成することができる。これらの塩も殺虫活性を示す。代表的な塩は、作物栽培学上許容しうる金属塩、アンモニウム塩および酸付加塩である。金属塩の中には、金属カチオンがナトリウム、カリウム、リチウムなどのアルカリ金属カチオン；カルシウム、マグネシウム、バリウム、ストロンチウムなどのアルカリ土類金属カチオン；また

は亜鉛、マンガン、第二銅、第一銅、第二鉄、第一鉄、チタン、アルミニウムなどの重金属カチオンであるものが含まれる。アンモニウム塩は、アンモニウムカチオンが式  $N R^5 R^6 R^7 R^8$  (式中  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$  および  $R^8$  の各々が独立に水素、ヒドロキシ、 $(C_1-C_4)$  アルコキシ、 $(C_1-C_{20})$  アルキル、 $(C_3-C_6)$  アルケニル、 $(C_3-C_6)$  アルキニル、 $(C_2-C_6)$  ヒドロキシアルキル、 $(C_2-C_6)$  アルコキシアルキル、 $(C_2-C_6)$  アミノアルキル、 $(C_2-C_6)$  ハロアルキル、アミノ、 $(C_1-C_4)$  アルキルまたは  $(C_1-C_4)$  ジアルキルアミノ、置換または未置換フェニル、置換または未置換フェニルアルキルでアルキル成分中4個以下の炭素原子を有する前記置換または未置換フェニルアルキルであるか、あるいは  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$  または  $R^8$  の何れか2種と一緒に窒素原子と共に環中もう一つの追加の複素原子(例えば酸素、窒素、または硫黄)までを選択的に有し、好ましくはピペリジノ、モルホリノ、ピロリジノ、ピペラジノなどの飽和した5または6員複素環式環を形成す

ンジルアンモニウム、 $n$ -ヘキシルアンモニウム、トリエチルアンモニウム、トリメチルアンモニウム、トリ( $n$ -ブチル)アンモニウム、メトキシエチルアンモニウム、ジイソプロピルアンモニウム、ピリジニウム、ジアルキルアンモニウム、ピラゾリウム、プロバルギルアンモニウム、ジメチルヒドラジニウム、オクタデシルアンモニウム、4-ジクロロフェニルアンモニウム、4-ニトロベンジルアンモニウム、ベンジルトリメチルアンモニウム、2-ヒドロキシエチルジメチルオクタデシルアンモニウム、2-ヒドロキシエチルジエチルオクチルアンモニウム、デシルトリメチルアンモニウム、ヘキシルトリエチルアンモニウム、4-メチルベンジルトリメチルアンモニウムなどを包含する。酸付加塩の中には、アニオンがハイドロクロリド、ハイドロブロミド、サルフェート、ニトレート、パークロレート、アセテート、オキサレートなどの作物栽培学上許容しうるアニオンであるものが包含される。

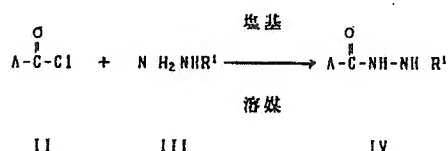
本発明の化合物またはそれらの前駆体は以下の

るか、あるいは  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$  または  $R^8$  の何れか3種と一緒に、窒素原子と共にピペラゾールまたはピリジンなどの5または6員芳香族複素環式環を形成する)で表わされるものを包含する。アンモニウム基中の  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$  または  $R^8$  置換基が置換フェニルまたは置換フェニルアルキルである場合フェニルおよびフェニルアルキル上の置換基は、一般にハロ、 $(C_1-C_6)$  アルキル、 $(C_1-C_4)$  アルコキシ、ヒドロキシ、ニトロ、トリフルオロメチル、シアノ、アミノ、 $(C_1-C_4)$  アルキルチオなどから選ばれる。このような置換フェニル基は、好ましくはこのような置換基の2種以下を有する。代表的なアンモニウムカチオンは、アンモニウム、ジメチルアンモニウム、2-エチルヘキシルアンモニウム、ビス(2-ヒドロキシエチル)アンモニウム、トリス(2-ヒドロキシエチル)アンモニウム、ジシクロヘキシルアンモニウム、 $\alpha$ -オクチルアンモニウム、2-ヒドロキシエチルアンモニウム、モルホリニウム、ピペリジニウム、2-フェネチルアンモニウム、2-メチルベ

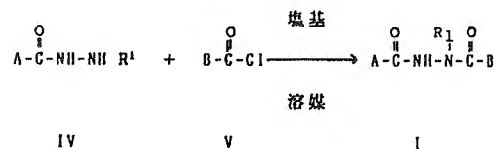
方法により得られる。方法Aは、XおよびX'が共に酸素である式Iの化合物を製造する場合に用いることができる。

#### 方法A:

##### 工程1



##### 工程2

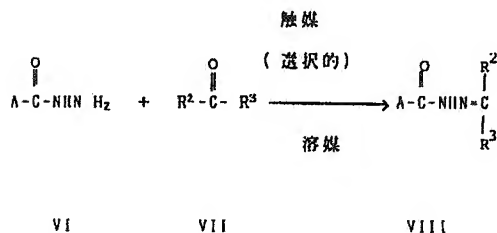


ここに、 $R^1$ 、 $A$  および  $B$  は式 I についての前記の  
定義通りであり、 $X$  および  $X'$  は酸基である。

別法として、XおよびX'が酸素であり、R<sup>1</sup>、AおよびBが式Iについて定義した通りである式Iの化合物を製造する場合に、方法Bを用いることができる。

**方法 B：**

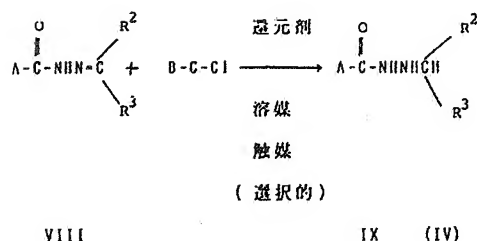
## 工程 I



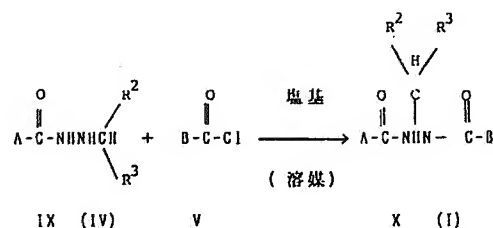
は式 I について前記定義した通りであり、 $R^2$  および  $R^3$  は、同じかまたは異なる水素または ( $C_2 - C_9$ ) 直鎖または分枝鎖アルキルであり、ただし  $R^2$  および  $R^3$  は共に H ではないか、あるいは  $R^2$  または  $R^3$  は他のもの ( $R^2$  または  $R^3$ ) が水素である場合には直鎖アルキル基ではない。上記の通り、工程 2 の中間生成物たる式 IX の化合物は式 IV の化合物に相当する。加えて、式 X の化合物は、X および X' が酸素である場合の式 I の化合物に相当する。

A、B および R<sup>1</sup> が式 I について上記定義の通りであって、X および X' の一方または両方が硫酸である場合の式 I の化合物を製造する場合に、方法 C を用いることができる。

## 工程 2



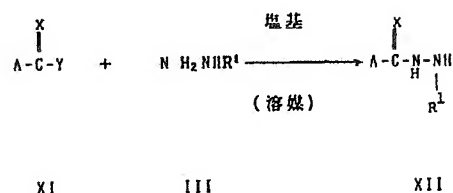
### 工程3



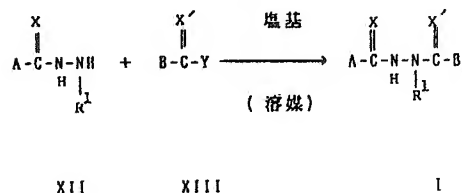
ここに、XおよびX'は酸素であり、AおよびB

方法 C:

## 工程 1



## 工程 2



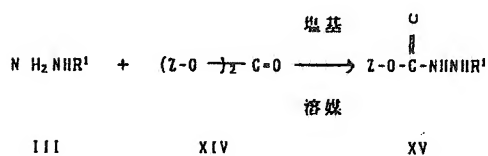
ここに、 $A$ 、 $B$ および $R^1$ は式Iについて上記定義の通りであり、 $X$ および $X'$ の一方または両方が硫黄であり、 $Y$ がカルボキシアルキルチオ(例え

ば、カルボキシメチルチオ-SG H<sub>2</sub>CO<sub>2</sub> H)；アルキルチオ（例えば、メチルチオ）；またはハロ（例えば、クロロ）などの良好な残基である。

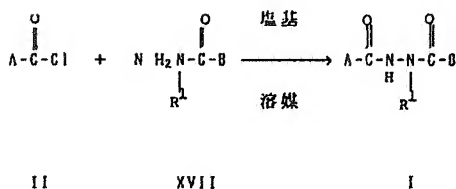
XおよびX'が酸素であり、R<sup>1</sup>、AおよびBが式Iについて前記定義の通りであるときの式Iの化合物を製造する場合に方法Dを用いることができる。

#### 方法D

##### 工程1



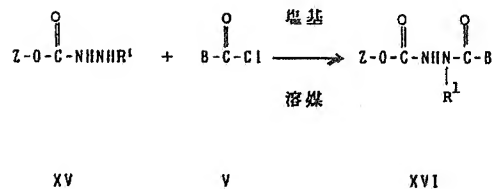
##### 工程4



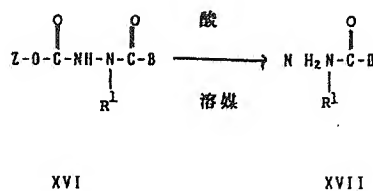
ここに、A、BおよびR<sup>1</sup>は式Iについての上記定義の通りであり、Zはメープチル；エチル；フェニル；またはベンジルである。

XおよびX'が酸素であり、R<sup>1</sup>、AおよびBが式Iについて上記定義した通りであるとき式Iの化合物を製造する場合に、方法Eを用いることができる。

##### 工程2

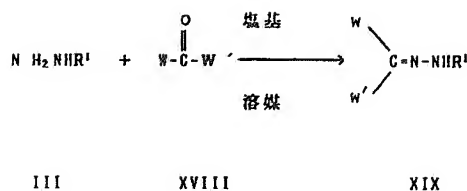


##### 工程3

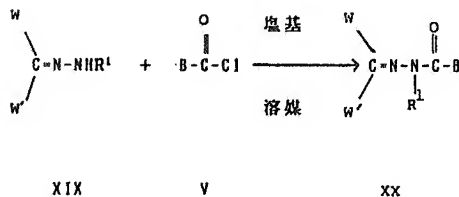


#### 方法E：

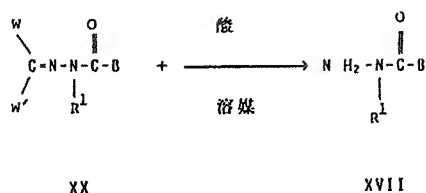
##### 工程1



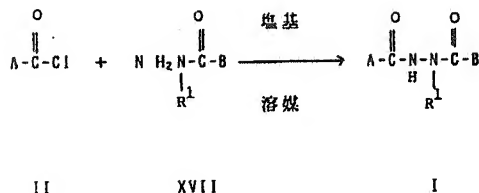
##### 工程2



## 工程 3



## 工程 4



ここに、 $\text{R}^1$ 、A および B は式 I についての上記定義の通りであり、W は水素、メチルまたはエチルであり； $\text{W}'$  はメチル、エチル、フェニルまたはイソブチルである。

方法 A において、式 II の化合物は、不活性また

ロリドなどをあげることができる。

式 II および／または式 V の化合物は、一般に市販されているか、または公知の方法で製造することができる。

上記方法で用いることができる式 III の化合物の例として、イソプロピルヒドラジン、n-ブチルヒドラジン、ネオペンチルヒドラジン、 $\alpha$ -メチルネオペンチルヒドラジン、イソブチルヒドラジン、イソペンチルヒドラジン、イソオクチルヒドラジンなどをあげることができる。式 III の化合物は、一般に市販されているか、または公知の方法で製造することができる。

上記方法で用いられる好適な溶媒は、水；メタノール、エタノール、イソプロパノールなどのアルコール；トルエン、キシレン、ヘキサン、ヘプタンなどの炭素水素；グリム；テトラヒドロフラン；アセトニトリル；ピリジン；またはメチレンクロリドなどのハロアルカンあるいはこれらの溶媒の混合物を包含する。

好ましい溶媒は、水、トルエン、メチレンクロ

は実質上不活性溶媒あるいは溶媒の混合物中、塩基の存在下、式 III のモノ置換ヒドラジンまたは塩酸塩などの対応する酸付加塩と反応させて式 IV の中間生成物を得、この中間生成物は単離するか、またはさらに不活性または実質上不活性溶媒、または溶媒の混合物中、塩基の存在下、式 V の化合物と反応させて式 I の所望の化合物を得ることができる。

上記方法で用いることができる式 II の化合物の例として、シクロヘキシルカルボニルクロリド、n-ブタノイルクロリド、n-ペンタノイルクロリド、フェニルアセチルクロリド、1-シクロヘキセンカルボニルクロリド、ピバロイルクロリド、トリクロアセチルクロリド、メタアクリロイルクロリドなどをあげることができる。

上記方法で用いることができる式 V の化合物の例として、ベンゾイルクロリド、4-クロロベンゾイルクロリド、4-メチルベンゾイルクロリド、3,5-ジクロロベンゾイルクロリド、2-プロモベンゾイルクロリド、3-シアノベンゾイルク

リドまたはこれらの溶媒の混合物である。

上記方法で用いられる塩基の例として、トリエチルアミンなどの第3級アミン；ピリジン；炭酸カリウム；炭酸ナトリウム；重炭酸ナトリウム；水酸化ナトリウム；または水酸化カリウムがあげられる。好ましい塩基は水酸化ナトリウム、水酸化カリウムまたはトリエチルアミンである。

方法 B において、式 VI の化合物は、不活性または実質上不活性溶媒または溶媒の混合物中、選択的には触媒の存在下、式 VII のケトンまたはアルデヒドと反応して式 VIII の中間生成物を得。次いで、式 VIII の中間生成物は、さらに不活性または実質上不活性溶媒または溶媒の混合物中、還元剤と反応して式 IX (IV) の第2の中間生成物を得、この第2の中間生成物は単離するか、またはさらに不活性または実質上不活性溶媒または溶媒の混合物中、塩基の存在下、式 V の化合物と反応して式 X (I) の所望の生成物を得ることができる。

上記方法 B に用いることができる式 VI の化合物

の例として、シクロヘキサンカルボン酸ヒドラジド、*n*-ブタン酸ヒドラジド、*n*-ペンタン酸ヒドラジド、フェニルアセトヒドラジド、1-シクロヘキセンカルボン酸ヒドラジド、ピバル酸ヒドラジド、トリクロロアセトヒドラジド、メタクリル酸ヒドラジドなどをあげることができる。式VIの化合物は、一般に市販されるか、または公知の方法で製造することができる。上記方法Bに用いることのできる式VIIの化合物の例として、1,1,1-トリメチルアセトアルデヒド、メチルエチルケトン、ジエチルケトンなどをあげることができる。式VIIの化合物は一般に市販されているか、または公知の方法で製造することができる。

選択的には、方法Bの工程Iにおいて、触媒を用いることができる。好適な触媒は、一般に酢酸、トリフルオロ酢酸、惨酸などの有機酸；塩酸、硫酸、硝酸などの鉱酸；トルエンスルホン酸などのアリールスルホン酸；またはピリジニウムトルエンスルホネートを含有する。好ましい触媒は、有機酸またはアリールスルホン酸である。最

選択的には、方法Bの工程2において、触媒を用いることができる。好適な触媒の例として、酢酸、トリフルオロ酢酸などの有機酸；または塩酸、硫酸などの鉱酸をあげることができる。好ましい触媒は有機酸または塩酸である。最も好ましい触媒は、酢酸、トリフルオロ酢酸または塩酸である。

上記方法Bの工程2に用いる好適な溶媒は、メタノール、エタノール、イソプロパノールなどのアルコール；テトラヒドロフラン(THF)、ジエチルエーテル、グリムなどのエーテル；メチレンクロリド、クロロホルムなどのハロ炭化水素を包含する。好ましい溶媒は、アルコールで、最も好ましいものはメタノールまたはエタノールである。

方法Bの工程3は、方法Aの工程2に相当する。したがって、方法Aの工程に用いる好適な塩基および溶媒は、上記した好ましい塩基および溶媒を含めて、方法Bの工程3に用いるのに好適である。

方法Cにおいて、式XIの化合物は、不活性ま

も好ましい触媒は酢酸またはトリフルオロ酢酸である。

上記方法Bの工程Iで用いられる好適な溶媒は、メタノール、エタノール、イソプロパノールなどのアルコール；トルエン、ベンゼンなどの炭化水素；テトラヒドロフラン(THF)、グリムなどのエーテル；またはジメチルホルムアミドを包含する。好ましい溶媒は、アルコールおよび炭化水素である。最も好ましい溶媒はメタノールまたはエタノールなどのアルコールである。

上記方法Bの工程2で用いられる好適な還元剤の例として、ナトリウムボロヒドリドなどのヒドリドおよびナトリウムシアノボロヒドリド、リチウムアルミニウムヒドリドおよびその誘導体などのその誘導体；またはジボランをあげることができる。好ましい還元剤は、ナトリウムボロヒドリドおよびその誘導体あるいはリチウムアルミニウムヒドリドおよびその誘導体である。還元剤として最も好ましいのはナトリウムシアノボロヒドリドである。

たは実質上不活性溶媒または溶媒の混合物中、塩基の存在下、式IIIのモノ置換ヒドラジンある塩酸塩などの対応する酸付加塩と反応して式XIIの中間化合物を得、この中間化合物は単離するか、またはさらに不活性または実質上不活性溶媒または溶媒の混合物中、塩基の存在下、式XIIIの化合物と反応させて式Iの所望の生成物を得ることができる。

上記方法Cに用いることができる式XIの化合物の例として、メチルチオ-チオブチレート、メチルチオ-チオペンタノエート、メチルチオ-チオシクロペンタンカルボキシレート、メチルチオ- $\alpha$ -フェニルチオアセテートなどをあげることができる。

上記方法Cで用いることのできる式XIIIの化合物の例として、3-メチルメチルチオ-チオベンゾエート、4-クロロメチルチオ-チオベンゾエート、4-メチル-メチルチオ-チオベンゾエート、カルボキシメチルチオ-チオベンゾエートなどをあげることができる。

式 XI および / または式 XII の化合物は、一般に市販されているか、または公知の方法で製造することができる。

上記方法 C で用いられる好適な溶媒は、ジメチルホルムアミド (DMF) ; グリム ; テトラヒドロフラン (THF) ; およびピリジンなどの一般に極性高沸点溶媒である。好ましい溶媒は、ピリジンである。

上記方法 C で用いられる好適な塩基は、トリエチルアミンなどの第 3 級アミン ; およびピリジンを包含する。好ましい塩基はピリジンである。

方法 D において、式 III のモノ置換ヒドラゾンまたは塩酸塩などの対応する酸付加塩は、不活性または実質上不活性溶媒または溶媒の混合物中、塩基の存在下、式 XIV の化合物と反応して式 XV の中間生成物が得られる。次いで、式 XV の中間生成物は、さらに不活性または実質上不活性溶媒または溶媒の混合物中、塩基の存在下、式 V の化合物と反応して式 XVI の第 2 の中間生成物が得られる。次いで式 XVI の第 2

包含する。

好ましい溶媒は、ジオキサン ; トルエン ; テトラヒドロフラン ; ピリジン ; メチレンクロリドまたは水である。最も好ましい溶媒は、ジオキサン ; 水またはトルエンである。

上記方法 D の工程 1, 2 および 4 で用いられる塩基の例として、トリエチルアミンなどの第 3 級アミン ; ピリジン ; 炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、重炭酸ナトリウム ; 水酸化ナトリウム ; および水酸化カリウムがあげられる。

好ましい塩基は水酸化ナトリウム ; 水酸化カリウム ; ピリジンまたはトリエチルアミンである。

上記方法 D の工程 3 で用いられる好適な溶媒は、メタノール、エタノールおよびイソプロパノールなどのアルコール ; 水 ; テトラヒドロフラン ; ジオキサン ; およびアセトニトリルを包含する。

好ましい溶媒は、メタノールまたはエタノールである。

上記方法 D の工程 3 に用いられる酸の例とし

中間生成物は、さらに不活性または実質上不活性溶媒または溶媒の混合物中、酸と反応して式 XVII の第 3 の中間生成物が得られる。次いで、式 XVII の第 3 中間生成物は不活性または実質上不活性溶媒または溶媒の混合物中、塩基の存在下、式 II の化合物と反応して式 I の所望の生成物が得られる。

上記方法 D に用いることのできる式 XIV の化合物の例として、ジ-*tert*-ブチルカーボネート、ジエチルカーボネート、ジフェニルカーボネート、ジベンジルカーボネートなどをあげることができる。式 XIV の化合物は、一般に市販されているか、または公知の方法で製造することができる。

上記方法 D の工程 1, 2 および 4 で用いられる好適な溶媒は、水 ; テトラヒドロフラン ; ジオキサン ; トルエン ; メタノール、エタノールおよびイソプロパノールなどのアルコール ; ヘキサン ; アセトニトリル ; ピリジン ; メチレンクロリドなどのハロアルカン ; またはこれらの溶媒の混合物を

て、濃塩酸または濃硫酸があげられる。

方法 E において、式 III のモノ置換ヒドラゾンまたは塩酸塩などの対応する酸付加塩は、不活性または実質上不活性溶媒または溶媒の混合物中、塩基の存在下、式 XVIII のケトンまたはアルデヒドと反応して式 XIX の中間生成物が得られる。次いで、式 XIX の中間生成物は、不活性または実質上不活性溶媒または溶媒の混合物中、塩基の存在下、式 V の化合物と反応して式 XX の第 2 の中間生成物が得られる。次いで、式 XX の第 2 中間生成物は、さらに不活性または実質上不活性溶媒または溶媒の混合物の存在下、酸と反応して式 XVII の第 3 の中間生成物が得られる。次いで式 XVII の第 3 中間生成物は、さらに不活性または実質上不活性溶媒または溶媒の混合物中、塩基の存在下、式 II の化合物と反応して式 I の所望の生成物が得られる。

上記方法 E に用いることのできる式 XVIII の化合物の例として、アセトン、ベンズアルデヒド、メチルエチルケトン、アセトフェノンおよびイソ



ブチルアルデヒドがあげられる。

好ましくは、アセトンが用いられる。式XVIIIの化合物は、一般に市販されているか、または公知の方法で製造することができる。

上記方法Eの工程1,2 および4で用いられる好適な溶媒は、メタノール、エタノール、イソプロパノールおよびn-プロパノールなどのアルコール；メチレンクロリド；トルエン；テトラヒドロフラン；アセトニトリル；水；エーテル；およびピリジンを包含する。

好ましい溶媒は、メタノールまたはエタノールなどのアルコール；トルエン；メチレンクロリド；水；テトラヒドロフラン；またはピリジンである。

最も好ましい 溶媒はメタノール、エタノール、トルエン、水またはピリジンである。

上記方法Eの工程1,2 および4で用いる塩基の例として、トリエチルアミン、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸カリウムおよびピリジンがあげられる。

所望により、より高いか、または低い圧力を用いることも可能である。

方法A、BおよびCにおいて、好ましくは、実質上等モルの反応体が用いられるが、所望により等モル量を超える量または等モル量に満たない量を用いることも可能である。

(以下余白)

好ましい塩基は、水酸化ナトリウムまたはピリジンである。

上記方法Eの工程3で用いる好適な溶媒は、メタノール、エタノール、イソプロパノールおよびn-プロパノールなどのアルコール；テトラヒドロフラン；トルエン；アセトニトリル；水；およびジオキサンを包含する。

好ましい溶媒は、メタノール、エタノール、テトラヒドロフランまたは水である。

上記方法Eの工程3で用いる酸の例として、稀塩酸または稀硫酸があげられる。

上記方法AおよびBは、約-20℃と約100℃との間の温度で行なうことができる。好ましくは、これらの反応は、約-5℃と約50℃との間で行なわれる。

方法Cは、約10℃と200℃との間の温度で行なうことができる。好ましくは、該反応は約70℃と約100℃との間で行なわれる。

方法A、BおよびCによる、本発明の化合物の製造は、好ましくはほぼ大気圧で行なわれるが、

一般に、式II、V、XIおよび/またはXIIの出発物質の当量当り約1当量の塩基が用いられる。式IIIのモノ置換ヒドラジンの酸付加塩が用いられる場合には、さらに1当量の塩基が用いられる。例えば、方法Aにおいて、置換基AおよびBが同じであって、モノ置換ヒドラジンが用いられる場合、式IIまたはVの好適に置換されたベンゾイルクロリドの約2当量が用いられるので、約2当量の塩基が用いられる。方法Aにおいて、置換基AおよびBが相違して、式IIIのモノ置換ヒドラジンの酸付加塩が用いられる場合、塩基の約2当量が工程1で用いられ、塩基の約1当量が工程2で用いられる。

上記方法DおよびEは、約0℃と約100℃との間の温度で行なうことができる。好ましくは、これらの反応は約0℃と約50℃との間で行なわれる。

方法DおよびEによる、本発明の化合物の製造は、好ましくはほぼ大気圧で行なわれるが、所望により、より高いか、または低い圧力を用いる

ことも可能である。

方法DおよびEにおいて、好ましくは実質上等モル量の反応体を用いられるが、所望により、より多いかまたは少ない量を用いることも可能である。

一般に、方法DおよびEの工程1, 2および4の各々において、出発物質または中間生成物の当量当たり、約1当量の塩基が用いられる。式IIIのモノ置換ヒドラジンの酸付加塩が用いられる場合、さらに追加の約1当量の塩基が用いられる。

特定のAおよび/またはB置換基の反応官能性に適応するために、上記方法の変更が必要となる。このような変更は、当業者に自明のことであらう。

本発明の式Iによって包含される、作物栽培学上許容しうる塩は、金属ヒドロキシド、金属ヒドリドあるいはハライド、ヒドロキシドまたはアルコキシドなどのアミンまたはアンモニウム塩を、1種以上のヒドロキシまたはカルボキシ基を有する式Iの化合物と反応させるか、あるいはクロリ

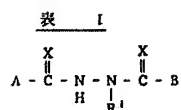
ド、ブロミド、ニトレートなどの第4級アンモニウム塩を、適当な溶媒中で、式Iの化合物の金属塩と反応させることにより得ることができる。金属ヒドロキシドが試薬として用いられる場合、有用な溶媒は水；グリムなどのエーテル；ジオキサン；テトラヒドロフラン；メタノール、エタノール、イソプロパノールなどのアルコールを包含する。金属ヒドリドが試薬として用いられる場合、有用な溶媒は例えば、ジオキサン、グリム、ジエチルエーテルなどのノンヒドロキシ溶媒；テトラヒドロフラン；トルエン、キシレン、ヘキサン、ペンタン、ヘプタン、オクタンなどの炭化水素；ジメチルホルムアミドなどを包含する。アミンが試薬として用いられる場合、有用な溶媒はメタノールまたはエタノールなどのアルコール；トルエン、キシレン、ヘキサンなどの炭化水素；テトラヒドロフラン；グリム；ジオキサン；水を包含する。アンモニウム塩が試薬として用いられる場合、有用な溶媒は水；メタノールまたはエタノールなどのアルコール；グリム；テトラヒドロフ

ランなどを包含する。アンモニウム塩がヒドロキシドまたはアルコキシド以外である場合、カリウムもしくはナトリウムヒドロキシド、ヒドリド、またはアルコキシドなどの追加の塩基が一般に用いられる。溶媒の特定の選定は、出発物質と得られる塩の相対的な溶解度に依存し、ある種の試薬の溶液よりもむしろスラリーが塩を得るのに用いることができる。一般に、当量の出発物質が用いられ、塩形成反応は、約0℃ないし約100℃、好ましくはほぼ室温で行なわれる。

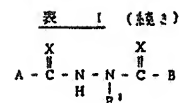
本発明の酸付加塩は、塩酸、臭酸、硫酸、硝酸、りん酸、酢酸、プロピオン酸、安息香酸または他の適当な酸を、適当な溶媒中で、塩基性官能基を有する式Iの化合物と反応させることにより得ることができる。有用な溶媒は、水、アルコール、エーテル、エステル、ケトン、ハロアルカンなどを包含する。溶媒の特定の選定は、出発物質と得られる塩の相対的な溶解度に依存し、ある種の試薬の溶液よりもむしろスラリーを、塩を得るのに用いることができる。一般に、当モル量の出

発物質が用いられ、塩形成反応は約-10℃ないし約100℃、好ましくはほぼ室温で行なわれる。

以下の実施例により本発明をさらに詳しく説明するが、これらの実施例は本発明を限定するためのものではない。表Iにおいて、得られた本発明のいくつかのN'-置換-N-アルキルカルボニルN'-アシルヒドラジンを表示する。構造は、NMRで確認され、場合によってはIRおよび/または元素分析によって確認された。実施例1, 3, 9, 11, 14 および15の化合物の特定の説明的製造について表Iの後に記載する。



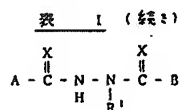
| 実施例<br>No | X | X' | R <sup>1</sup>                    | A  | B   | 融点 °C   |
|-----------|---|----|-----------------------------------|--|---|---------|
| 1         | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> |  | -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                      | >250    |
| 2         | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 | -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> Cl-4                 | 177-179 |
| 3         | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                      | 87-90   |
| 4         | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> Cl-4                 | 179-180 |
| 5         | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> -4   | 127-128 |
| 6         | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 | -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                      | 114-115 |
| 7         | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> F-4                  | 143-144 |
| 8         | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CF <sub>3</sub> -4   | 195-196 |
| 9         | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                   | -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                      | 150-152 |
| 10        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> Cl-4                 | 195-196 |
| 11        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> |  | -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                      | 185-187 |
| 12        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -CH <sub>2</sub> Cl  | -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                      | 172-173 |
| 13        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -CHClI <sub>2</sub>  | -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                      | 192-193 |
| 14        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -CCl <sub>3</sub>  | -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                      | 139-141 |
| 15        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl                             | -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                      | 233-234 |
| 16        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -C(Cl)-CCl <sub>2</sub>  | -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                      | 184-186 |
| 17        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> Cl <sub>2</sub> -3,4 | 157-158 |
| 18        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> -3   | 65-78   |
| 19        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -C(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub>   | -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                      | 127-130 |
| 20        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> |  | -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                      |         |



| 実施例<br>No | X | X' | R <sup>1</sup>                    | A                                     | B   | 融点 °C             |
|-----------|---|----|-----------------------------------|---------------------------------------|---|-------------------|
| 21        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> |                                       | -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> -3                   | 190-192           |
| 22        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> |                                       | -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> -3                   | 160-162.5         |
| 23        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> |                                       | -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> Cl <sub>2</sub> -3,4                 | 110-112           |
| 24        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> |                                       | -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> Cl <sub>2</sub> -3,4                 | low melting solid |
| 25        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> |                                       | -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> -3                   | oil               |
| 26        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -CH=CHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> -3                   | 141-146           |
| 27        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>   | -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> -3                   | 110-115           |
| 28        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> |                                       | -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> -3                   | oil               |
| 29        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>    | -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -3,5 | 136-138           |
| 30        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> |                                       | -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -3,5 | 155-163           |
| 31        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>    | -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> Br-2                                 | 160-162           |

実施例 No 1-N'-<sup>ルノ</sup>ニル-<sup>ルノ</sup>ベンゾイルヒドラジンの製造

トルエン (30ml) 中、<sup>ルノ</sup>ニル-<sup>ルノ</sup>ベンゾイルヒドラジン塩酸塩 (2.0g, 0.016M) の攪拌懸濁液に、50% 水酸化ナトリウム (1.3g, 0.016M) を添加した。15分後、混合物を 5℃ に冷却し、シクロヘキサンカルボニルクロリド (2.4g, 0.016M) および 50% 水酸化ナトリウム (1.3g, 0.016M) を、反応温度を 10℃ 以下に維持するように、別々にそして同時に添加した。添加後、反応混合物を温めさせて室温とし、1 時間攪拌した。該混合物をヘキサンで希釈し、濾過により固体生成物を単離した。この生成物 (1.5g, 0.008M) を、トルエン (30ml) の攪拌混合物で溶解し、氷上で冷却した。この混合物に、ベンゾイルクロリド (1.1g, 0.008M) および 50% 水酸化ナトリウム (0.6g, 0.008M) を同時に添加した。添加後、混合物を、1/2 時間攪拌し、ヘキサンで希釈し、濾過により、固体生成物たる N'-<sup>ルノ</sup>ニル-<sup>ルノ</sup>ベンゾイルヒドラジンを単離した。



| 実施例<br>No | X | X' | R <sup>1</sup>                    | A                                  | B   | 融点 °C   |
|-----------|---|----|-----------------------------------|------------------------------------|---|---------|
| 32        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                    | 129-131 |
| 33        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> |                                    | -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> -3 | glass   |
| 34        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> |                                    | -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> -3 | glass   |
| 35        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> |                                    | -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> -3 | oil     |
| 36        | O | O  | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> |                                    | -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> -3 | 207-210 |

実施例 No 3-N'-t-ブチル-N-バレリール-N'-  
ベンゾイルヒドラジンの製造

5℃のトルエン(150 ml)中、t-ブチルヒドラジン塩酸塩(24.8g, 0.20 モル)の攪拌懸濁液に、50% NaOH水溶液16gを30 mlに稀釈して得られたNaOHの1当量を添加した。添加後、バレリールクロリド(24g, 0.2モル)およびNaOH溶液(30 ml)の別の1当量を、別々に、そして同時に滴下した。反応混合物を温め~~て~~室温とし、40分間攪拌した。二層混合物を分離し、有機層を水およびブラインで洗浄した。有機層を、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>上で乾燥し、真空中に濃縮して無色油を得た。

5℃のトルエン(40 ml)中、1-t-ブチル-2-バレリールヒドラジン(4g, 0.023M)の攪拌溶液に、ベンゾイルクロリド(3.4g, 0.024M)および50% NaOH水溶液(0.98g, 0.024M)を添加した。添加後混合物を温めて室温とし、2.5時間攪拌した。混合物をエチルアセテート(50 ml)で稀釈し、水(2×25 ml)およびブライン(1×25 ml)で洗浄した。有機層を、硫酸マグネシウム上で乾燥

し、真空中に濃縮し、黄色油として、N'-t-ブチル-N-バレリール-N'-ベンゾイルヒドラジンを得た。

し、真空中に濃縮し、黄色油として、N'-t-ブチル-N-バレリール-N'-ベンゾイルヒドラジンを得た。

実施例 No 9-N'-t-ブチル-N-フェニルアセチル  
-N'-ベンゾイルヒドラジンの製造

トルエン(30 ml)中、t-ブチルヒドラジン塩酸塩(2.0g, 0.016 M)の攪拌懸濁液に、50% 水酸化ナトリウム(1.3g, 0.016M)を添加した。15分後、混合物を5℃に冷却し、フェニルアセチルクロリド(2.4g, 0.016M)および50% 水酸化ナトリウム(1.3g, 0.016M)を、反応温度15℃以下に維持するように、別々に、かつ同時に添加した。添加後、反応混合物を温めて室温とし、1時間攪拌した。該混合物をヘキサンで稀釈し、<sup>濾過により</sup>固体生成物を単離した。この生成物(3.2g, 0.015M)を、トルエン(30 ml)の攪拌混合物中で溶解し、氷上で冷却した。この混合物に、ベンゾイルクロリド(2.2g, 0.016M)および50% 水酸化ナトリウム(1.3g, 0.016M)を同時に添加した。添加後、混合物を1/2時間攪拌し、ヘキサンで稀釈し、濾過により、固

体生成物たるN'-t-ブチル-N-フェニルアセチル-N'-ベンゾイルヒドラジンを単離した。

実施例 No 11-N'-t-ブチル-N-シクロヘキセニル  
カルボニル-N'-ベンゾイルヒドラジンの  
製造

トルエン(30 ml)中、t-ブチルヒドラジン塩酸塩(0.86g, 0.007M)の攪拌懸濁液に、50% 水酸化ナトリウム(0.55g, 0.007M)を添加した。15分後、混合物を5℃に冷却し、シクロヘキセニルカルボニルクロリド(1.0g, 0.007M)および50% 水酸化ナトリウム(0.55g, 0.007M)を、反応温度を10℃以下に維持するように、別々に、かつ同時に添加した。添加後、反応混合物を温めて室温とし、1時間攪拌した。該混合物をヘキサンで稀釈し、固体生成物を濾過により単離した。この生成物(1.2g, 0.005M)を、トルエン(30 ml)の攪拌混合物中で溶解し、氷上で冷却した。この混合物に、ベンゾイルクロリド(1.0g, 0.007M)および50% 水酸化ナトリウム(1.3g, 0.007M)を同時に添加した。添加後、混合物を1/2時間攪拌し、ヘキサンで

稀釈し、濾過により、固体生成物たるN'-t-ブチル-N-シクロヘキセニルカルボニル-N'-ベンゾイルヒドラジンを単離した。

実施例 No 14-N'-t-ブチル-N-(β-クロロビバ  
ロイル)-N'-ベンゾイルヒドラジンの製  
造

アセトン(400 ml)中、t-ブチルヒドラジン塩酸塩(200g, 1.61モル)の攪拌懸濁液に、トリエチルアミン(200g, 1.98モル)を滴下した。添加後、定期的に硫酸マグネシウム(全量100g)を添加しつつ、混合物を3時間蒸流した。混合物を室温に冷却し、漏斗で濾過した。濾液を硫酸マグネシウム上で乾燥し、スラリーが形成されるまで、5℃で真空中に濃縮した。混合物をエチルアセテート(100 ml)で稀釈し、濾過した。濾液を蒸留して黄色油(沸点121-127℃)を得た。

5℃のトルエン(250 ml)中、1-t-ブチル-2-アセトンヒドラゾン(43g, 0.34モル)の攪拌懸濁液に、10% 水酸化ナトリウム水溶液(200 ml, 0.50モル)を添加した。添加後、ベンゾイルクロ

リド(70g, 0.50 モル)をこの混合物に滴下した。5℃で2時間攪拌を継続し、室温で72時間攪拌した。混合物をエチルアセテート(300ml)で稀釈し、水(3×200 ml)およびブライン(200ml)で洗浄した。有機層を硫酸マグネシウム上で乾燥し、真空下35℃で濃縮して黄色油を得た。

1- $\epsilon$ -ブチル-1-ベンゾイル-2-アセトンヒドラゾン(90g, 純度約60%, 約0.3 モル)、エタノール(500ml, 200 ブルーフ)および10%塩酸(500ml)の混合物を、室温で1晩中攪拌した。混合物を真空下に濃縮して濃厚スラリーとした。該スラリーを水洗(400ml)しつつ吸引濾過した。固形分を1晩中空乾した。該固形分を、スチーム浴上、水(200 ml)およびメタノール(100ml)溶液に溶解した。混合物を1晩中室温で放置した。混合物を吸引濾過し、冷水(100ml)で洗浄し、固形分を1晩中空乾した。固形分を10%塩酸(300ml)に溶解し、エチルアセテート(3×300ml)で洗浄した。エチルアセテート洗浄液を一結にし、10%塩酸(250ml)で抽出した。10%塩

酸層を一結にして、攪拌しながら<sup>50%</sup>水酸化ナトリウム水溶液で中和した。室温で1時間攪拌を継続した。混合物を吸引濾過し、水(100ml)で洗浄し、固形分を空乾して白色固体(融点125-126℃)を得た。

5℃に冷却したトルエン(40 ml)中、1- $\epsilon$ -ブチル-1-ベンゾイルヒドラジン(1g, 0.005M)の攪拌溶液に、3-クロロ-2,2-ジメチルプロピオニルクロリド(1.2g, 0.007M)、および50%水酸化ナトリウム水溶液(0.45g, 0.0056M)を、温度を10℃以下に維持するように、添加した。混合物を温めて室温とし、1時間攪拌した。混合物をヘキサン(40 ml)および水(10 ml)で稀釈した。白色固体生成物たるN'- $\epsilon$ -ブチル-N-( $\beta$ -クロロビバロイル)-N'-ベンゾイルヒドラジンを吸引濾過によって単離し、ヘキサン50 mlおよび水50 mlで洗浄し、乾燥した。

実施例 No 15-N'- $\epsilon$ -ブチル-N-(1,2,2-トリクロロビニル)カルボニル-N'-ベンゾイルヒドラジンの製造

アセトン(400ml)中、 $\epsilon$ -ブチルヒドラジン塩酸塩(200g, 1.61モル)の攪拌懸濁液に、トリエチルアミン(200g, 1.98モル)を滴下した。添加後、硫酸マグネシウム(合計100g)を定期的に添加しながら、混合物を3時間還流した。混合物を室温に冷却し、漏斗で濾過した。濾液を硫酸マグネシウム上で乾燥し、スラリーが形成されるまで5℃で真空下に濃縮した。混合物をエチルアセテート(100ml)で稀釈し、濾過した。濾液を蒸留して淡黄色気味の油(沸点121-127℃)を得た。

5℃のトルエン(250ml)中、1- $\epsilon$ -ブチル-2-アセトンヒドラゾン(43g, 0.34モル)の攪拌懸濁液に、10%水酸化ナトリウム水溶液(200ml、<sup>洗浄を目的に</sup>0.50モル)を添加した。添加後、ベンゾイルクロリド(70g, 0.50 モル)を滴下した。5℃で2時間、次いで室温で72時間攪拌を継続した。混合物をエチルアセテート(300ml)で稀釈し、水(3×200 ml)およびブライン(200ml)で洗浄した。有機層を硫酸マグネシウム上で乾燥し、真空下35℃で濃縮して黄色油を得た。

1- $\epsilon$ -ブチル-2-アセトンヒドラゾン(90g, 純度約60%, 約0.3 モル)、エタノール(500ml, 200 ブルーフ)および10%塩酸(500ml)の混合物を、室温で1晩中攪拌した。混合物を真空下に濃縮して濃厚スラリーを得た。スラリーを吸引濾過し、水(400ml)で水洗した。固形分を1晩中空乾した。

固形分を、スチーム浴上、水(200 ml)およびメタノール(100ml)溶液に溶解した。混合物を、1晩中室温で放置した。混合物を吸引濾過し、冷水(100ml)で洗浄し、固形分を1晩中空乾した。固形分を10%塩酸(300ml)に溶解し、エチルアセテート(3×300ml)で洗浄した。エチルアセテート洗浄液を一結にして、10%塩酸(250ml)で抽出した。10%塩酸層を一結にして、攪拌しつつ50%水酸化ナトリウム水溶液で中和した。室温で1時間攪拌を継続した。混合物を吸引濾過し、水洗(100ml)し、固形分を空乾して白色固体(融点125-126℃)を得た。

5℃のメチレンクロリド中、1- $\epsilon$ -ブチル-1-

ベンゾイルヒドラジン (1.5g, 0.008M) の攪拌溶液に、トリクロロアクリロイルクロリド (1.7g, 0.009M) およびトリエチルアミン (0.9g, 0.009M) を同時に、かつ別々に添加した。添加後、混合物を温めて室温とし、3時間攪拌した。フラスコの内容物を、メチレンクロリド 50ml で稀釈し、水 (3×75 ml) およびブライン溶液 (1×75 ml) で洗浄した。有機層を硫酸マグネシウム上で乾燥し、真空下に溶媒を除去し、白色固体生成物として N'-t-ブチル-N-(1,2,2-トリクロロビニル) カルボニル-N'-ベンゾイルヒドラジンを得た。

実施例 1, 3, 9, 11, 14 および 15 の化合物の製造により上記例示のように、方法 A, B, C, D および E における操作に実質上従うことにより、表 I の化合物が製造された。

前記したように、本発明の化合物は、すぐれた殺虫活性を示し、蝶蛾類鱗翅目および甲虫目の昆虫に対して選択的である。

一般に農業、園芸および林業における昆虫の防除に対しては、ヘクタール当り活性物質約 10g な

いし約 10Kg に相当する薬量が用いられ、ヘクタール当り約 100g ないし約 5 Kg が好ましい。ある状態に対する薬量の正確な量は、所定の手順で決めることが可能であり、種々の因子、例えば使用される物質、病害虫の種類、使用される製剤、病害虫がたかっている作物の状態およびその時の天候条件に依存する。本願の明細書で用いられる「殺虫性」(“insecticidal”) なる用語は、対象昆虫の生存または生長に悪影響を及ぼす手段と解されるべきである。このような手段は、完全死滅作用、根絶、生長阻止、阻害、数の減少およびそれらの組合せを包含することができる。本願明細書に用いられる「防除」(“control”) なる用語は、「殺虫性」(“insecticidal”) あるいは植物を虫害から保護することを意味するものと解されるべきである。「殺虫有効量」(“insecticidally effective amount”) により、活性物質の薬量が昆虫「防除」を発揮するのに充分であることを意味する。

実用に際しては、本発明の化合物は組成物また

は製剤の形で用いることができる。組成物および製剤の製造例は、the American Chemical Society 発行 “Pesticidal Formulation Research,” (1969); Wade Van Valkenburg 著, Advances in Chemistry Series No 86; Wade Van Valkenburg 編集, the Marcel Dekker, Inc. 発行 “Pesticide Formulations,” (1973) に見ることができる。これらの組成物および製剤において、活性物質は、通常の組成物または製剤に用いることのできる種類の、通常の不活性な作物栽培学上許容しうる (すなわち植物と合性および/または殺虫不活性の) 稀釈剤あるいは固体担体物質または液体担体物質などの増量剤と混合される。作物栽培学上許容しうる担体は、活性成分の有効性を害することなく組成物中に活性成分を溶解、分散または拡散するのに用いることが可能であり、かつそれ自体、土壌、装盤、所望植物または作物栽培学環境に著しい有害効果を有しない物質を意味する。所望ならば、表面活性剤、安定剤、消泡剤および漂流飛散防止剤などの、補助剤を添加してもよい。

本発明の組成物および製剤の例として、水溶液および水性分散液、油状溶液および油状分散液、ペースト、粉剤、水和剤、乳剤、フロアブル、粒剤、ベイト、インバートエマルジョン、フロアブル組成物およびくん蒸キャンドルをあげることができる。

水和剤、ペースト、フロアブルおよび乳剤は、使用前または使用中水で稀釈される濃縮配合物 (製剤) である。

ベイトは、一般に、食物または対象病害虫をひきつける他の物質であって、少なくとも 1 種の致死または非致死の毒物を含有するものからなる配合物である。致死毒物は、ベイトで摂取させて病害虫を殺すものであるが、非致死毒物は防除の目的のために、病害虫の行動、摂食習慣および生理を変えるものである。

インバートエマルジョンは、主として空中散布用に用いられ、その場合広い面積が比較的少量の配合物で処理される。インバートエマルジョンは、活性物質の油溶液または油分散液中に水を乳

化させることにより、スプレー作業直前またはスプレー作業中にも調整することができる。

組成物および製剤は、公知の方法、例えば、活性化化合物を通常の分散性液体稀釈剤担体おとび／または分散性固体担体、選択的には担体ビヒクル助剤、例えば通常の表面活性剤の使用と共に、また乳化剤おとび／または分散剤を包含するもので増量して得られ、その際、例えば水が稀釈剤として用いられる場合には、有機溶媒が助溶媒として添加される。下記のもの、この目的のため通常の担体ビヒクルとして用いられるものと通常考えることができる：ブタン、プロパン、窒素および二酸化炭素ならびにハロゲン化炭化水素、例えばジクロロジフルオロメタンおよびトリフルオロクロロメタンなど、標準温度および圧力でガス状であるエアゾル噴射剤；芳香族炭化水素（例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン、アルキルナフタレンなど）、ハロゲン化、特に塩素化芳香族炭化水素（例えば、クロロベンゼンなど）、シクロアルカン（例えば、シクロヘキサンなど）、パラフ

イン（例えば、石油または鉱油留分）、塩素化脂肪族炭化水素（例えば、メチレンクロリド、クロロエチレンなど）、植物油（例えば、大豆油、棉実油、コーン油など）、アルコール（例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、グリコールなど）、ならびにエーテルおよびそのエステル（例えば、グリコールモノメチルエーテルなど）、アミン（例えば、エタノールアミンなど）、アミド（例えば、ジメチルホルムアミドなど）、スルホキシド（例えば、ジメチルスルホキシドなど）、アセトニトリル、ケトン（例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、シクロヘキサノン、イソホロンなど）などの不活性有機溶媒おとび／または水を含有する不活性分散性液体稀釈剤担体；カオリン、クレイ、タルク、チョーク、水晶、アタパルガイド、モンモリロナイトまたはけいそう土などの粉碎天然鉱物、および高分散性珪酸、アルミナおよびシリケートなどの粉碎合成鉱物を含有する固体担体；カルサイト、マーブル、ブミス、セビ

オライトおよびドロマイトなどの粉碎し分級した天然ロック、ならびに無機および有機ミール（meals）の粒状物おとびおがくず、ココナツシェル、コーンコブおとびタバコストークなどの有機物質の粒状物を包含する粒剤用固体担体。以下のものは、通常の担体ビヒクル助剤と一般に考えられている：カチオン性おとび／またはノニオン性おとび／またはアニオン性乳化剤（例えば、脂肪酸のポリエチレンオキシドエステル、脂肪アルコールのポリエチレンオキシドエーテル、アルキルスルフェート、アルキルスルホネート、アリアルスルホネート、アルブミン加水分解生成物など、特にアルキルアリアルポリグリコールエーテル、マグネシウム、ステアレート、ナトリウムオレエートなど）などの乳化剤；おとび／またはリグニン、重硫酸廃液、メチルセルロースなどの分散剤。

粉剤、粒剤またはラチス（latices）の形のカルボキシメチルセルロース、おとび天然または合成ポリマーなど、例えばガムアラビック、ポリビニルアルコールおとびポリビニルアセテートなどの

粘着剤を、製剤に用いることができる。

所望ならば、本発明の化合物を含有する組成物おとび製剤に、例えば酸化鉄、酸化チタンおとびベルシアンプルーなどの無機顔料、おとびアリザリン染料、アゾ染料おとび金属フタロシアニン染料などの有機染料などの着色剤、ならびに鉄、マンガ、ン、ボロン、銅、コバルト、モリブデンおとび亜鉛の塩などの微量栄養素を用いることができる。

本発明の活性化化合物は、単独で、あるいは相互のおとび／またはこのような固体おとび／またはは液体分散性担体ビヒクルとのおとび／または他の殺虫剤、殺節足動物剤、殺線虫剤、殺カビ剤（fungicides）、殺菌剤（bactericides）、殺そ剤、除草剤、肥料、生長調節剤、協力剤などの、他の公知の和合性活性剤、特に植物保護剤との混合物の形で、所望ならば、あるいは直ちに使用に供しうる、溶液、エマルジョン、懸濁液、粉剤、ペーストおとび粒剤など、活性化化合物から得られる、特定の用途のための特別の投与配合物の形で

用いることができる。

市販の配合物に関しては、これらの配合物は一般に担体組成物混合物を意図しており、該配合物においては、活性化合物は、該配合物に対して実質上約0.1重量%ないし99重量%、好ましくは1重量%ないし75重量%存在する。直接施用あるいは<sup>一般に</sup>ほ場施用のための好適な担体組成物混合物は、活性化合物が混合物の重量に対して、実質上約0.0001%ないし5%、好ましくは約0.001%ないし3%用いられるものを意図している。したがって、本発明は、(1)分散性不活性微粉砕担体固体、および/または(2)好ましくは担体ビヒクル助剤(例えば表面活性剤、乳化剤および/または分散剤など)の表面活性有効量を含有する、不活性有機溶媒および/または水などの分散性担体液体、および所期の目的に対して有効である組成物の重量に対して、約0.0001%ないし約99%、好ましくは約0.001%ないし約90%、より好ましくは約0.01%ないし約75%の量の活性化合物の混合物よりなるすべての製剤および組成物を意図する

り、該方法は本発明の少なくとも1主の活性化合物のみのそれぞれ攻撃または毒性量(すなわち、殺虫有効量)と、あるいは上記した担体ビヒクル(組成物または製剤)と共に、昆虫を接触させることを特徴とする。本願明細書で用いる「接触させること」(“contacting”)なる用語は、それ自体のまたは組成物または製剤の構成成分としての本発明の活性化合物を、(a)このような昆虫および(b)その生息地(すなわち、例えば生長している作物に対して保護される場所、または作物が生長する領域)の少なくとも1つに施用することと解されるべきである。この製剤または組成物は、通常の方法、例えば散布、噴霧、蒸発、まき散らし、散粉、散水、噴出、スプリंक、注ぎ、くん蒸、ドライドレッシング、モイストドレーシング、ウェットドレッシング、スラリードレッシング、上皮形成などにより施用される。

もちろん、担体ビヒクルとの混合物に用いられる特別の活性化合物の濃度は、使用される装置、施用方法、処理される地域、防除されるべき病害

ものである。

前記活性化合物は、通常の高ガロン量スプレー、低ガロン量スプレー、超低容量スプレー、エアブラストスプレー、エアリアルスプレーなど一般に用いられる方法によるスプレーとして、また粉剤として施用することができる。もし低容量施用が望ましいならば、該化合物の溶液が通常用いられる。超低容量施用の場合、活性化合物を含有する液体組成物が、飛行機作物散布技術を用いて、噴霧装置により、微粉状(平均粒径約50ないし100ミクロンまたはそれ以下)のスプレー(例えばミスト)として通常施用される。一般には、ヘクタール当たりほんの数リットルが必要であり、しばしば約15~1000g/ヘクタールであり、好ましくは約40~600g/ヘクタールで充分である。超低容量では、活性化合物約20~約95重量%を含有する液体担体ビヒクルと共に高濃度液体組成物を用いることが可能である。

さらに、本発明は、病害虫を選択的に殺すか、攻撃するか、または防除する方法を意図してお

虫の種類および病害虫のたかりの程度などの因子に依存するものである。したがって、特別な場合には、上記濃度範囲の上に出たり、下に下ったりすることも可能である。

粒状配合物は、例えば活性物質を溶媒に吸収させ、得られた溶液を用いて、場合によっては結合剤の存在下、多孔質粒状物(例えば軽石およびアタクレイ(attaclay)またはチョップトタバコステムなどの粒状担体物質に含浸させることにより得られる。

粒状配合物(しばしば「ペレット」と呼ばれる)は、あるいは、潤滑剤および結合剤の存在下、粉状質物と共に活性物質を圧縮し、得られたコンボジットを砕解し、変形して所望の粒度とすることによっても得ることができる。

粉剤は、約1ないし約50重量%の濃度で、活性物質と不活性固体担体物質とよく混合することにより得ることができる。好適な固体担体物質の例として、タルク、カオリン、パイプクレイ、けいそう土、クロマイト、石こう、チョーク、ベント



ナイト、アタパルジャイトおよびコロイドSiO<sub>2</sub>またはこれらの混合物および類似物質があげられる。あるいは、例えば粉砕ウオルナツシエルなどの有機担体物質も用いることができる。

水和剤およびフロアブルは、例えば上記担体物質などの固体不活性担体約10〜約99重量部を、選択的にアセトンなどの揮発性溶媒に溶解した活性物質約1〜約80重量部、この目的のために公知の、リグノスルホネートまたはアルキルナフタレンスルホネートなどの分散剤約1〜約5重量部および、好ましくは脂肪アルコールスルフェートまたは脂肪酸縮合生成物のアルキルアリアルスルホネートなどの湿潤剤約0.5〜約5重量部と混合することにより得られる。フロアブルの場合、水などの液体不活性担体も用いられる。

乳剤を製造するために、活性化合物は好適な溶媒に溶解されるか、または該溶媒中で微粉砕されるが、該溶媒は好ましくは水と混和しにくいものであり、乳化剤が得られる溶液に添加される。好適な溶媒の例として、キシレン、トルエン、高沸

点芳香族石油蒸留物、例えばソルベントナフサ、蒸留タール油およびこれらの液体の混合物があげられる。好適な乳化剤の例として、アルキルフェノキシポリグリコールエーテル、脂肪酸のポリオキシエチレンソルビタンエステルまたは脂肪酸のポリオキシエチレンソルビトールエステルがあげられる。これらの乳化剤の活性化合物の濃度は、狭い範囲内に限定されず、堆物溶解度により、約2重量%および約50重量%の間で変動することができる。乳剤以外の好適な高濃度液体一次組成物は、例えばアセトンなどの水と容易に混和しうる液体中の活性物質の溶液であり、この溶液に分散剤および、場合によっては、湿潤剤がされる。このような一次組成物が散布作業直前または作業中に水で稀釈されると、活性物質の水分散液が得られる。

本発明のエアゾル配合物は、活性物質またはその適当な溶媒中の溶液を、メタンおよびエタンの塩素およびフッ素誘導体の混合物などの、噴射剤として用いるのに好適な液体中に混入することに

より、通常の方法で得られる。

くん蒸キャンドルまたはくん蒸粉剤、すなわち燃焼して殺虫性スモークを発生することのできる配合物は、例えば燃料としての、好ましくは粉砕状態の、シュガーまたは木材、例えば硝酸アンモニウムまたはクロレートなどの燃焼を持続させる物質、およびさらにカオリン、ベントナイトおよび/またはコロイド珪酸などの燃焼を抑制する物質よりなる燃焼性混合物中に、活性物質を吸収させることにより得られる。

ベイト剤は、植物または病害虫をひきつける他の物質、担体および堆物よりなり、選択的には、細菌およびカビ生長を防止する防腐剤、湿潤条件下の粉砕を防止する防水剤および上記の染料または着色剤など、この種の配合物に一般に用いられる他の物質を包含することができる。

上記成分に加えて、本発明の配合物は、この種の配合物に一般に用いられる他の物質も包含することができる。

例えば、ステアリン酸カルシウムまたはステアリン酸マグネシウムなどの湿潤剤は、水和剤または粒状化されるべき混合物に添加することができる。さらに、例えばポリビニルアルコールセルローズ誘導体またはカゼインなどの他のコロイド物質などの「粘着剤」を添加して、保護される表面へのこの殺虫剤の粘着を改善することができる。

本発明の化合物を包含する組成物および製剤の代表的な製造について、説明のため、しかし限定のためではなく、実施例AないしIとして以下に説明する。

#### 実施例 A

#### 粒 剤

| 成 分                                     | 重量%   |
|---|-------|
| 堆物および堆物不純物                              | 0.25  |
| Triton <sup>®</sup> X-305 (登録商標) (結合剤)  | 0.25  |
| (オクチルフェニル-30-エチレンオキシドエタノール)             |       |
| Agisorb <sup>®</sup> 24/48 (登録商標) (稀釈剤) | 99.50 |
| (モントモリロナイト クレー)                         |       |

製造：毒物およびTriton<sup>®</sup> X-305 をメチレンクロリドに溶解し、その混合物を、混合しながら、Agso<sup>®</sup>に添加した。次いでメチレンクロリドを蒸発させた。

実施例 B粉 剤

| 成 分        | 重量%  |
|------------|------|
| 毒物および毒物不純物 | 1.0  |
| タルク        | 99.0 |

製造：毒物を過剰のアセトンに溶解し、その混合物をタルクに含浸させた。次いでアセトンを蒸発させた。

実施例 C水和剤

| 成 分                                    | 重量%  |
|--|------|
| 毒物および毒物不純物                             | 31.3 |
| Duponal <sup>®</sup> Dry (登録商標) (ウエター) | 2.0  |
| (ナトリウムラウリルスルフェート)                      |      |
| Reax <sup>®</sup> 45A (登録商標) (分散剤)     | 5.0  |
| (ナトリウムリグニンスルホネート)                      |      |

(下記表面活性剤：

カルシウムドデシルベンゼンスルホネート；およびエトコシ化アルキルフェノールのアニオン性およびノニオン性ブレンド)

シクロヘキサノン (溶媒) 22.5

Tenneco<sup>®</sup> 500-100 (登録商標) (溶媒) 52.5

(290-345° F の沸点範囲を有し、主としてキシレン、クメンおよびエチルベンゼンよりなる芳香族溶媒混合物)

製造：均質透明溶液が得られるまで、攪拌しながら、全成分を一括に混合した。

実施例 Eエアゾル

| 成 分        | 重量%  |
|------------|------|
| 毒物および毒物不純物 | 0.5  |
| フレオン 12    | 99.5 |

製造：各成分を混合して、放出スプレーバルブを備えた適当な容器に加圧下収納した。

実施例 F

バードンクレー (稀釈剤) 31.7

Hisil<sup>®</sup> 233 (稀釈剤) 30.0

(ナトリウムシリカ)

製造：選択的に揮発性溶媒に溶解した毒物を、バードンクレーおよびHisil<sup>®</sup> (登録商標) 担体に吸収させた。次いで、Duponal<sup>®</sup> (登録商標) およびReax<sup>®</sup> (登録商標) を添加し、乾燥混合物全部を均質になるまでブレンドした。次いで、該組成物を超微粉碎して微粒径とした。

実施例 D乳 剤

| 成 分                                   | 重量%  |
|---------------------------------------|------|
| 毒物および毒物不純物                            | 15.0 |
| Sponto <sup>®</sup> 232T (登録商標) (乳化剤) | 6.0  |

(下記表面活性剤：

カルシウムドデシルベンゼンスルホネート；およびエトコシ化アルキルフェノールのアニオン性およびノニオン性ブレンド)

Sponto<sup>®</sup> 232T (登録商標) (乳化剤) 4.0

くん蒸キャンドルまたはくん蒸粉

| 成 分        | 重量%  |
|------------|------|
| 毒物および毒物不純物 | 1.0  |
| 木材粉        | 96.0 |
| でんぶん       | 3.0  |

製造：毒物、木材粉およびでんぶんと一緒にブレンドし、次いで、でんぶんを活性化するために、少量の水を用いて成型してキャンドルとした。

実施例 Gペイト方法 A

| 成 分                                   | 重量%   |
|---------------------------------------|-------|
| 毒物および毒物不純物                            | 1.00  |
| ふすま (担体および誘引剤)                        | 89.95 |
| コーンシロップ (誘引剤)                         | 7.00  |
| コーンオイル (誘引剤)                          | 2.00  |
| Kathon <sup>®</sup> 4200 (登録商標) (防腐剤) | 0.05  |

(3-イソチアゾロン)

製造：コーンオイルおよびコーンシロップを、充分混合しながら、ふすまに添加した。毒物および

Kathon® (登録商標) を過剰のアセトンと予備混合し、その混合物を、混合しながら、ふすまベースに添加した。次いでアセトンを蒸発させた。

#### 方法 B

| 成 分               | 重量%   |
|-------------------|-------|
| 毒物および毒物不純物        | 0.06  |
| 粒状シュガー (担体および誘引剤) | 99.94 |

#### 実施例 H

##### ペレット

実施例 G の方法 A と同じであるが、以下の通り追加：該ペント組成物を、適当なダイおよびプレス装置を用いて、径 1/4"、長さ 3/8" のペレット状に成型した。

#### 実施例 I

##### フロアブル

| 成 分   | 重量%  |
|---|------|
| 毒物および毒物不純物                                      | 31.3 |
| Duponal® Dry (登録商標) (ウェッジ)<br>(ナトリウムラウリルスルフェート) | 2.0  |
| Reax® 45A (登録商標) (分散剤)                          | 5.0  |

例えば、2,2-ビス(p-クロロフェニル)-1,1,1-トリクロロエタンおよびヘキサクロロエポキシオクタヒドロジメタノナフタレンなどの塩素化炭化水素；例えば N-メチル-1-ナフチルカーバメートなどのカーバメイト；例えば、2-メチル-4,6-ジニトロフェノールおよび 2-(2-ブチル)-4,6-ジニトロフェニル-3,3-ジメチルアクリレートなどのジニトロフェノール；ジメチル-2-メトキシ-3-カルボニル-1-メチルビニルホスフェート、0,0-ジエチル-O-p-ニトロフェニルホスホロチオエート；0,0-ジメチルジチオホスホリル酢酸の N-モノメチルアミドなどの有機りん化合物；例えば p-クロロベンジルまたは p-クロロフェニルスルフィドおよび 2,4,4',5'-テトラクロロジフェニルスルフィドなどのジフェニルスルフィド；例えば p-クロロフェニルベンゼンスルホネートなどのジフェニルスルホネート；例えば、4,4-ジクロロ-1-トリクロロメチルペンズヒドロールなどのメチルカルビノール；メチルキノキサリンジチオカーボネートなどのキノキ

(ナトリウムリグニンスルホネート)

Hsil® 233 (登録商標) (種衣剤) 30.0

(ナトリウムシリカ)

Kelzan® (登録商標) (増粘剤) 0.5

(キサントガム)

水 31.2

製造：毒物を Hsil® (登録商標) 担体に吸収させた。次いで、Duponal® (登録商標) および Reax® (登録商標) を添加し、乾燥混合物全部を、均質になるまでブレンドした。この組成物を超微粉砕して微粒径とした。得られた粉末を、水中に懸濁させ、Kelzan® (登録商標) を添加した。

本発明の組成物および製剤は、公知の殺虫性化合物を含有することも可能である。このことは、前記配合物の活性のスペクトルを増大させ、相乗作用をもたらすことができる。

下記の公知の殺虫性、殺菌性 (fungicidal) および殺ダニ性化合物は、このような組合せ配合物に用いるのに適当である。

サリン化合物；N'- (4-クロロ-2-メチルフェニル)-N,N-ジメチルホルムアミジンなどのアミジン；アレスリンなどのピレスロイド；バシルス (Bacillus) スリングエンシス (theriנגiensis) 菌化合物 ~~など~~ などの応用生物学的製剤 (Biologicals)；トリシクロヘキシル錫ヒドロキシドなどの有機錫化合物；およびピペロニルブトキシドなどの協力剤などの殺虫剤。

例えば、フェニル水銀アセテートおよびメチル銀シアノグアニドなどの有機水銀化合物；例えば、トリフェニル錫ヒドロキシドおよびトリフェニル錫アセテートなどの有機錫化合物；例えば、亜鉛エチレンビスチオカーバメイトおよびマンガンエチレンビスチオカーバメイトなどのアルキレンビスチオカーバメイト；および 2,4-ジニトロ-5-(2-オクチルフェニルクロトネート)、1-ビス (ジメチルアミノ) ホスホリル-3-フェニル-5-アミノ-1,2,4-トリアゾール、6-メチルキノキサリン-2,3-ジチオカーボネート、1,4-ジチオアンスラキノ-2,3-ジカーボニトリル、N-トリク

ロロメチルチオフタルイミド、N-トリクロロメチルチオ<sup>テトラ</sup>ヒドロフタルイミド、N-(1,1,2,2-テトラクロロエチルチオ)-<sup>ヒド</sup>テトラフタルイミド、N-ジクロロフルオロメチルチオ-N-フェニル-N'-ジメチルスルホニルジアミドおよびテトラクロロイソフタロニトリルなどの殺菌剤(fungicides)。

#### 生物活性

生物的评价により、本発明の化合物は殺虫活性を有し、病害虫、特に蝶蛾類鱗翅目および甲虫目に属する昆虫の幼虫および成虫を防除することができるが見出された。当業者ならば、ある昆虫に対するある化合物の活性ならびに必要な量を定める方法を知っている。

前記したように、本発明の化合物は棉、野菜、コーンおよび他の禾穀などの、しかしこれらに限定されない、栽培植物；かぼの木、トウモロコシ植物、松、モミなどの、しかしこれらに限定されない、森林；および装飾用植物、花および樹木の作物における植物破壊性昆虫を防除するのに特に好適である。本発明の化合物は、また、種子などの

貯蔵品；果実および／またはかんきつ類樹木、キイチゴ灌木などの、しかしこれらに限定されない、果実作物；および芝ふ(lawn)、芝土(sod)などの、しかしこれらに限定されない、芝生地(turf)を破壊する昆虫を防除するのに特に好適である。

本発明の化合物の殺虫活性を評価するのに際し、下記の試験方法を用いた。

試験化合物を溶媒(アセトン：メタノール、1：1)に溶解し、水を加えて5：5：90のアセトン：メタノール：水系とし、次いで表面活性剤を添加することにより、600ppmを含有する試験溶液をつくった。アルキルアリールポリエーテルアルコール(登録商標Triton® X-155として市販)および変性フタル酸グリセロールアルキル樹脂(登録商標Triton® B-1956として市販)の1:1混合物を、表面活性剤として、試験溶液の100ガロン当り1オンスに相当する量だけ用いた。

最初の評価を、下記の病害虫の1種以上について行なった。

| 記号  | 一般名                                      | ラテン名   |
|-----|--|--|
| SAW | サザンアーミーワーム<br>(Southern Armyworm)        | スポドプテラ<br>エリダニア<br>(Spodoptera<br>eridania)  |
| MBB | メキシカンビーンビー<br>トル(Mexican Bean<br>Beetle) | エピラチナ<br>バリベスチス<br>(Epilachna<br>varivestis) |

莢につくビーンビートルおよびアーミーワーム試験について、個々のビーン〔(ファセオラス(Phaseolus)リメンジス(limensis)パール(var)ウッド(Woods')のプロリフィック(Prolific)〕莢を、ペトリ皿中の濾紙の湿潤片上に置いた。次いでそれらの莢に、回転するターンテーブルを用いて試験溶液を散布し、乾燥させた。前記ペトリ皿に、サザンアーミーワームまたはメキシカンビーンビートルの第3中間形態幼虫10匹をたからせた。次いで、前記皿の莢をした。ビーンビートルおよびアーミーワームに対する死亡率(百分率評

価)を96時間処理後行なった。評価は、0～100%のスケールに基づくものであり、0は活性のないことに等しく、100は全部殺されたのに等しい。回転するターンテーブルは、固定され、連続的に作動するスプレーノズルよりなり、該ノズルの下に、対象が一定速度および距離で回転されている。対象が(例えばアーミーワームについて)ペトリ皿である場合、ノズルからの距離は15インチである。ノズルは、回転軸から8インチの所にある。個々のプラットホーム上の対象は、20秒当り1回転の場合で軸の回りに回転するが、この時間の短い部分だけがスプレー通路に出会う。対象は1回だけノズルの下を通過し、次いで取り除かれ、乾燥フードに移される。

使用されるノズルは、No 2850フルードキャップおよびNo 70エアキャップを備えた1/4 JCO スプレーイングシステムズ(Spraying Systems)(Wheaton Illinois)空気噴霧ノズルである。使用される空気圧10psigにおいて、液体サイホンで、フィールド0.5GPH(時間当りガロン)がスプレー角21°で円

いスプレーパターンに送り出される。対象はスプレー小滴<sup>で該小滴</sup>が凝集して試験生物をおぼれさせるには不十分な、均一な薄膜を形成する程度に、噴霧される。

処理はすべて、よく換気された部屋で、連続蛍光下、75~80°Fに維持される。

土壌処理（浸透性）試験については、前記600ppm試験溶液の1部を希釈して150ppmとする。150ppm試験溶液の10mlをピペットでとって、ライマメ苗を含有する3インチポットの土壌（標準温室土壌約200g）に移した。これは、約8ppmの土壌濃度となる。処理した植物を1週間、その温室の条件下に維持した。2枚のライマメの葉を取り出して、それぞれベトリ皿中の湿潤濾紙の上に置いた。1枚の葉に、メキシカンビーンビートルの第3中間形態幼虫10匹をたからせた。もう1枚の葉に、サザンアーミーワームの第3中間形態幼虫10匹をたからせた。次いで前記皿の蓋をし、3日間保持し、その間に防除率（死亡率）百分率を測定した。もし、実験者が、効果が完全でないか

も知れないと思うか、死にかけている昆虫が回復しそうに見えるようであると思うならば、第2回目の観察を、前記皿にたからせてから6日後に行なってもよい。必要な場合には、未処理のライマメの葉を、第2回目の観察のために留めておいた皿に入れて昆虫が餓死するのを防ぐようにする。

最初の殺虫性評価の結果を表IIに示す。

アーミーワームおよびビーンビートルスプレー（葉面）結果は、96時間観察値である。土壌処理結果は、72時間観察値である。実験者の自由で、特別の評価が144時間観察値についてなされた。144時間後、もし防除率百分率に変化があれば、かっこで示される。

表 II  
生物的评价

| 実験番号 | 葉面施用          |     | 土壌施用          |         |
|------|---------------|-----|---------------|---------|
|      | 試験種 (Species) |     | 試験種 (Species) |         |
|      | SAW           | MBB | MBB           | SAW     |
| 1    | 100           | 0   | 20            | 100     |
| 2    | 100           | 60  | 20            | 40(60)  |
| 3    | 70            | 100 | 80(20)        | 40(100) |
| 4    | 100           | 40  | 40            | 0(80)   |
| 5    | 0             | 10  | 0(40)         | 0(20)   |
| 6    | 90            | 60  | 80(60)        | 0(20)   |
| 7    | 20            | 10  | 0(40)         | 40(60)  |
| 8    | 0             | 0   | 0(20)         | 0       |
| 9    | 70            | 100 | 20(40)        | 0       |
| 10   | 80            | 70  | 40(100)       | 40(80)  |
| 11   | 100           | 0   | 0             | 100     |
| 12   | 30            | 0   | 0             | 0       |
| 13   | 0             | 90  | 80(100)       | 0       |
| 14   | 0             | 80  | 0(80)         | 0       |
| 15   | 0             | 70  | 0             | 0       |
| 16   | 100           | 20  | 0             | 0       |
| 17   | 70            | 40  | 0             | 0       |
| 18   | 100           | 0   | -             | 1       |
| 19   | 0             | 0   | 0             | 0       |
| 20   | 60            | 30  | 0(20)         | 0       |

1 データ報告なし。

表 II (続き)  
生物的评价

| 実験番号 | 葉面施用          |     | 土壌施用          |     |
|------|---------------|-----|---------------|-----|
|      | 試験種 (Species) |     | 試験種 (Species) |     |
|      | SAW           | MBB | MBB           | SAW |
| 21   | 100           | 0   | -             | -   |
| 22   | 100           | 0   | -             | -   |
| 23   | 0             | 20  | -             | -   |
| 24   | 0             | 30  | -             | -   |
| 25   | 90            | 40  | -             | -   |
| 26   | 100           | 30  | -             | -   |
| 27   | 100           | 100 | -             | -   |
| 28   | 20            | 40  | -             | -   |
| 29   | 100           | 50  | -             | -   |
| 30   | 100           | 30  | -             | -   |
| 31   | 0             | 80  | -             | -   |
| 32   | 0             | 40  | -             | -   |
| 33   | 50            | 30  | -             | -   |
| 34   | 100           | 30  | -             | -   |
| 35   | 100           | 10  | -             | -   |
| 36   | 100           | 100 | -             | -   |

本願明細書および実施例は説明のために記載されたものであって、限定のために記載されたものではなく、また特許請求の範囲に定義された本発明の精神および範囲を逸脱することなく、各種の修正と変更をなしうるものと理解されるべきである。

特許出願人

ローム アンド ハース コンパニー

代理人

若 林 忠

第1頁の続き

| ⑤Int.Cl. <sup>4</sup> | 識別記号  | 庁内整理番号    |
|-----------------------|-------|-----------|
| A 01 N 37/34          | 1 0 2 | 8519-4H   |
| 43/30                 |       |           |
| 47/22                 |       |           |
| C 07 C 121/417        |       | C-8519-4H |
| 121/82                |       | 7451-4H   |
| 125/06                |       | 7451-4H   |
| 143/78                |       | 6785-4H   |
| 143/86                |       | E-7188-4H |
| 145/00                |       | 7188-4H   |
| 147/107               |       | 7188-4H   |
| 147/14                |       | J-7188-4H |
| 149/273               |       | 7188-4H   |
| 153/05                |       | C-7188-4H |
| C 07 D 317/46         |       | 7419-4H   |
| 325/00                |       | 7822-4C   |